

## NOVEL SULFONYL DERIVATIVE

**Publication number:** JP2001294572 (A)

**Publication date:** 2001-10-23

**Inventor(s):** KOBAYASHI SHOZO; KOMORIYA SATOSHI; OGINOYA NORIYASU; SUZUKI MASANORI; YOSHINO TOSHIJI; NAGAHARA TAKAYASU; YOSHIKAWA KENJI; MUTO AKIRA; OSANAI TAKESHI; NAKAMOTO ARIYOSHI; MOCHIZUKI AKIYOSHI; NAGATA TSUTOMU +

**Applicant(s):** DAIICHI SEIYAKU CO +

**Classification:**

- international: C07D295/22; A61K31/343; A61K31/4365; A61K31/472; A61K31/4725; A61K31/495; A61K31/496; A61K31/5025; A61K31/519; A61K31/5355; A61K31/5375; A61K31/5377; A61K31/5383; A61K31/695; A61P7/02; A61P9/00; A61P9/10; A61P43/00; C07D209/42; C07D215/48; C07D217/26; C07D235/06; C07D277/68; C07D307/84; C07D333/68; C07D417/12; C07D471/04; C07D487/04; C07D491/048; C07D495/04; C07D498/04; C07D513/04; C07F7/18; C07D295/00; A61K31/343; A61K31/4353; A61K31/472; A61K31/495; A61K31/496; A61K31/5025; A61K31/519; A61K31/5355; A61K31/5375; A61K31/695; A61P7/00; A61P9/00; A61P43/00; C07D209/00; C07D215/00; C07D217/00; C07D235/00; C07D277/00; C07D307/00; C07D333/00; C07D417/00; C07D471/00; C07D487/00; C07D491/00; C07D495/00; C07D498/00; C07D513/00; C07F7/00; (IPC1-7): C07F7/18; C07D209/42; A61K31/343; A61K31/4365; A61K31/4725; A61K31/495; A61K31/496; A61K31/5025; A61K31/519; A61K31/5377; A61K31/5383; A61K31/695; A61P7/02; A61P9/00; A61P9/10; A61P43/00; C07D215/48; C07D217/26; C07D235/06; C07D277/68; C07D295/22; C07D307/84; C07D333/68; C07D417/12; C07D471/04; C07D487/04; C07D491/048; C07D495/04; C07D498/04; C07D513/04

- European:

**Application number:** JP20000038100 20000209

**Priority number(s):** JP20000038100 20000209

### Abstract of JP 2001294572 (A)

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To obtain a novel sulfonyl derivative, salts thereof and solvates thereof that have strong FXa-inhibitory action, manifests promptly, sufficiently and sustainingly anti-thrombogenic effect with reduced side effects and are useful as excellent anticoagulant drugs.

**SOLUTION:** This invention release to a compound represented by the general formula (I): Q1-Q2-T1-Q3-SO2-QA (I) (wherein Q1 is a saturated or unsaturated bicyclic condensed ring group which may be substituted or a saturated or unsaturated tricyclic condensed ring group which may be substituted; Q2 is a single bond, oxygen atom, sulfur atom, a straight or branched chain 1-6C alkylene, and the like; QA is an aryl-alkenyl which may be substituted, a heteroarylalkenyl which may be substituted, and the like; T1 denotes carbonyl group, or the like), the salts thereof and the solvates thereof.

Data supplied from the **espacenet** database — Worldwide

(19) 日本国特許庁 (J P)

## (12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2001-294572

(P2001-294572A)

(43) 公開日 平成13年10月23日 (2001.10.23)

(51) Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テーマコード* (参考)
C 0 7 D 209/42		C 0 7 D 209/42	4 C 0 3 1
A 6 1 K 31/343		A 6 1 K 31/343	4 C 0 3 3
31/4365		31/4365	4 C 0 3 4
31/4725		31/4725	4 C 0 3 7
31/495		31/495	4 C 0 5 0
審査請求 未請求 請求項の数17 O L (全 304 頁) 最終頁に続く			

(21) 出願番号 特願2000-38100(P2000-38100)

(22) 出願日 平成12年2月9日 (2000.2.9)

(71) 出願人 000002831

第一製薬株式会社

東京都中央区日本橋3丁目14番10号

(72) 発明者 小林 祥三

東京都江戸川区北葛西1丁目16番13号 第

一製薬株式会社東京研究開発センター内

(72) 発明者 小森谷 聡

東京都江戸川区北葛西1丁目16番13号 第

一製薬株式会社東京研究開発センター内

(72) 発明者 萩野谷 憲康

東京都江戸川区北葛西1丁目16番13号 第

一製薬株式会社東京研究開発センター内

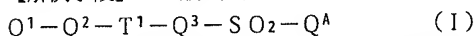
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 新規スルホニル誘導体

## (57) 【要約】

【課題】 F X a 阻害作用が強く、経口投与で速やかに十分且つ持続的な抗血栓効果を得られる副作用の少ない、優れた抗凝固薬としての新規なスルホニル誘導体、その塩およびそれらの溶媒和物を提供する。

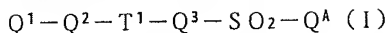
【解決手段】 一般式 (I)



[式中、Q<sup>1</sup>は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基を意味する。Q<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、硫黄原子、直鎖状もしくは分枝状の炭素数1～6のアルキレン基などを意味する。Q<sup>A</sup>は置換基を有することもあるアリールアルケニル基、置換基を有することもあるヘテロアリールアルケニル基などを意味する。T<sup>1</sup>はカルボニル基などを意味する。] で表される化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】 一般式(1)



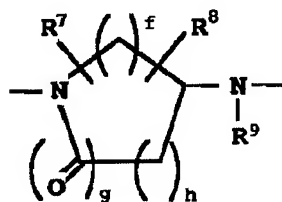
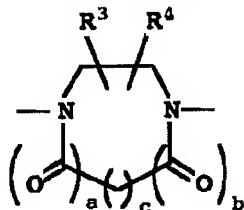
〔式中、 $Q^1$ は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基を意味する。 $Q^2$ は単結合、酸素原子、硫黄原子、直鎖状もしくは分枝状の炭素数1～6のアルキレン基、直鎖状もしくは分枝状の炭素数2～6のアルケニレン基、直鎖状もしくは分枝状の炭素数2～6のアルキニレン基、

基-N( $R^1$ )-CO-

(基中、 $R^1$ は水素原子またはアルキル基を意味する。)、

基-N( $R^2$ )-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-

(基中、 $R^2$ は水素原子またはアルキル基を意味し、 $m$  \*



(これらの基中、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^{10}$  および  $R^{11}$ が結合する炭素原子が窒素原子に隣り合わないときは、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、アルキル基、アルコキシル基、アルコキシアルキル基、アルコキシアルキルオキシ基、ヒドロキシアルキル基、ヒドロキシアルキルオキシ基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、ホルミル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルスルホニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシル基、カルボキシアルキル基、カルボキシアルキルオキシ基カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキルスルホニルアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキルオキシ基、アルコキシカルボニルアルキルカルボニル基、アルコキシカルボ

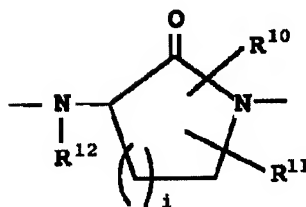
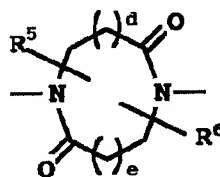
\*は0～6の整数を意味する。)、または基

## 【化1】



(この基は、置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基、置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基、または置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基を意味する。←Cはこの基の炭素原子が $Q^1$ と結合することを示す。)を意味する。 $Q^3$ は以下のいずれかの基を意味する。

## 【化2】



ニルアルキルスルホニル基、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルキルスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアリースルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキル基、

シアノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルコキシアルキルアミノカルボニルアルキル基、アルキルカルボニルオキシアルキル基、または基  $A^1-B^1-$  (基中、 $A^1$ は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味する。 $B^1$ は単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、基- $O-C_1\sim C_6$ アルキレン基、基- $COO-C_1\sim C_6$ アルキレン基、基- $NHCO-$ または基- $NHCO-C_1\sim C_6$ アルキレン基を意味する。)を意味する。また、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^{10}$ および $R^{11}$ が結合する炭素原子が窒素原子に隣り合うときはそれぞれ独立して、水素原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、ホルミル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルスルホニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシル基、カルボキシアルキル基、カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキルスルホニルアルキル基、アルコキシアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキルスルホニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルキルスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアリールスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキル基、シアノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルコキシアルキルアミノカルボニルアルキル基、アルキルカルボニルオキシアルキル基、または基  $A^2-B^2-$  (基中、 $A^2$ は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味する。 $B^2$ は単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、基- $O-C_1\sim C_6$ アルキレン基、基- $COO-C_1\sim C_6$ アルキレン基、基- $NHCO-$ または基- $NHCO-C_1\sim C_6$ アルキレン基を意味する。)を意味する。また、 $R^3$ および $R^4$ 、 $R^5$ および $R^6$ 、 $R^7$ および $R^8$ 、 $R^{10}$ および $R^{11}$ は環を構成する炭素原子とともに一緒にな

って置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～7員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～7員の複素環式基を意味してもよく、 $R^9$ および $R^{12}$ はそれぞれ独立して、水素原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、アルコキシル基、アルコキシアルキル基、アルコキシアルキルカルボニル基、アルコキシアルキルスルホニル基、ホルミル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシアルキル基、カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキルスルホニルアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキルスルホニル基、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルオキシアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルキルスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアリールスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキル基、シアノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルコキシアルキルアミノカルボニルアルキル基、またはアルキルカルボニルオキシアルキル基を意味する。また、 $R^9$ は $R^7$ または $R^8$ と一緒に環を構成する炭素原子と $R^9$ が結合する窒素原子とともに、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～7員の複素環式基を意味してもよい。また、 $R^{12}$ は $R^{10}$ または $R^{11}$ と一緒に環を構成する炭素原子と $R^{12}$ が結合する窒素原子とともに、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～7員の複素環式基を意味してもよい。a、b、d、eおよびgはそれぞれ独立して、0または1の整数を意味する。cは0から3の整数を意味する。f、hおよびiはそれぞれ独立して、1から3の整数を意味する。ただし、aとbとcの和は2または3の整数を意味



し、d および e の和は 0 または 1 の整数を意味し、f と g と h の和は 3 から 5 の整数を意味する。)

$Q^A$  は置換基を有することもあるアリールアルケニル基、置換基を有することもあるヘテロアリールアルケニル基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 2 環性の縮合環基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 3 環性の縮合環基、基  $A_r - C(H) = N -$  (基中、 $A_r$  は置換基を有することもあるアリール基を意味する。) または基  $Het - C(H) = N -$  (基中、 $Het$  は置換基を有することもあるヘテロアリール基を意味する。) を意味する。 $T^1$  はカルボニル基、基  $-CH(R^{13}) -$

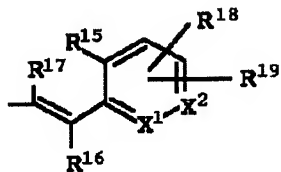
(基中、 $R^{13}$  は水素原子、アルキル基、水酸基が保護されることもあるヒドロキシアルキル基、アルコキシアルキル基、カルボキシアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アリール基、アラールキル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基またはアミノ基部分に置換基(保護基)を有することもあるアミノアルキル基を意味する。)

基  $-C(=NOR^{14}) -$  または 基  $-C(=N-NH$  20  $R^{14'}) -$

(基中、 $R^{14}$  および  $R^{14'}$  はそれぞれ独立して、水素原子、アルキル基、カルボキシアルキル基、アルコキシカルボニル基、アリール基、アラールキル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基またはアミノ基部分に置換基を有することもあるアミノアルキル基を意味する。) を意味する。] で表される化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

【請求項 2】 式 (I) 中、 $Q^A$  が以下のいずれかの基を意味するものである請求項 1 に記載の化合物、その塩 30 およびそれらの溶媒和物。

【化 3】

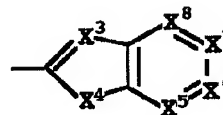


[基中、 $R^{15}$  は水素原子、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシル基、アルコキシアルキル基、カルボキシル基、カルボキシアルキル基、アルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルキルカルボニルオキシ基、または基  $A^3 - B^3 -$

(基中、 $A^3$  は置換基を 1 個もしくは 2 個有することもあるアミノ基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5 ~ 6 員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5 ~ 6 員の複素環式基を意味する。 $B^3$  は単結合、カルボニル基、アルキレ

ン基、カルボニルアルキル基、カルボニルアルキルオキシ基、またはアルキレンカルボニルオキシ基を意味する。) を意味する。 $R^{16}$  および  $R^{17}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、水酸基が保護されることもあるヒドロキシアルキル基またはアルコキシアルキル基を意味する。また、 $R^{16}$  または  $R^{17}$  は、 $R^{15}$  と一緒になって炭素数 1 ~ 3 のアルキレン基またはアルケニレン基を意味してもよい。 $R^{18}$  および  $R^{19}$  はそれぞれ独立して、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、ハロゲノアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基、トリフルオロメチル基、シアノ基、アミノ基、アミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、アミジノ基、ヒドロシミアミジノ基またはアルコキシカルボニルアミジノ基を意味する(ただし、 $R^{18}$  および  $R^{19}$  は同時に水素原子であることはない。)。  $X^1$  および  $X^2$  はそれぞれ独立してメチン基または窒素原子を意味する。]

【化 4】



[基中、 $X^3$  は窒素原子または基  $=C(R^{100}) -$

(基中、 $R^{100}$  は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシカルボニル基、アラールキルオキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、ニトロ基、保護基を有することもあるアミノ基またはアミノ基部分に保護基を有することもあるアミノアルキル基を意味する。) を意味する。 $X^4$  は酸素原子、硫黄原子または

基  $-N(R^{101}) -$

(基中、 $R^{101}$  は水素原子、アルキル基、アルコキシカルボニル基、アラールキルオキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルキルスルホニル基またはアリールスルホニル基を意味する。) を意味する。 $X^5$  および  $X^8$  はそれぞれ独立して窒素原子または

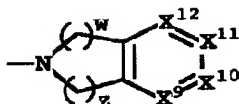
基  $-C(R^{102}) -$

(基中、 $R^{102}$  は、水素原子またはハロゲン原子を意味する。) を意味する。 $X^6$  および  $X^7$  はそれぞれ独立して窒素原子または

基  $-C(R^{103}) -$

(基中、 $R^{103}$  は、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、ハロゲノアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基、シアノ基、アミノ基、アミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、アミジノ基、ヒドロシミアミジノ基またはアルコキシカルボニルアミジノ基を意味する。)]

【化5】



〔基中、 $X^9$ および $X^{12}$ はそれぞれ独立して窒素原子または

基-C ( $R^{104}$ ) -

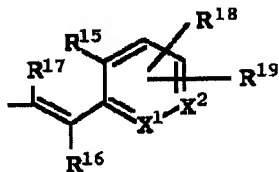
(基中、 $R^{104}$ は、水素原子またはハロゲン原子を意味する。)を意味する。 $X^{10}$ および $X^{11}$ はそれぞれ独立して窒素原子または

基-C ( $R^{105}$ ) -

(基中、 $R^{105}$ は、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、ハロゲンアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基、シアノ基、アミノ基、アミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基またはアルコキシカルボニルアミジノ基を意味する。)  $w$ および $z$ はそれぞれ独立して1または2の整数を意味する。]

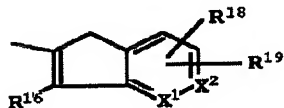
【請求項3】 一般式(1)における基

【化6】



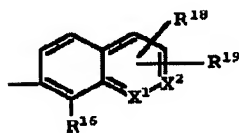
が、

【化7】



または

【化8】

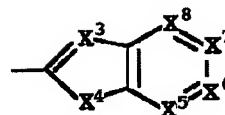


〔上記基中、 $R^{16}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{19}$ 、 $X^1$ および $X^2$ は前記に同じ。〕を意味するものである請求項2記載の化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

【請求項4】  $R^{18}$ がハロゲン原子またはエチニル基を意味するものである請求項2または請求項3に記載の化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

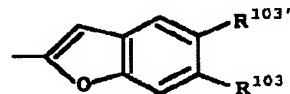
【請求項5】 一般式(1)における基

【化9】

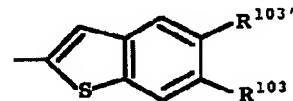


が、以下の基のいずれかのもを意味するものである請求項2記載の化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

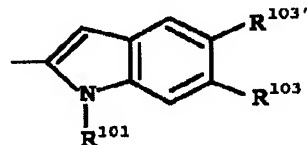
【化10】



【化11】



【化12】

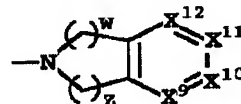


〔上記基中、 $R^{101}$ および $R^{103}$ は前記に同じ。 $R^{103'}$ は $R^{103}$ と同様のものを意味する。〕

【請求項6】  $R^{103}$ または $R^{103'}$ のどちらか一方がハロゲン原子またはエチニル基を意味するものである請求項5に記載の化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

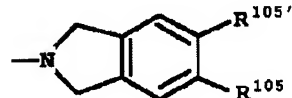
【請求項7】 一般式(1)における基

【化13】



が

【化14】



〔基中、 $R^{105}$ は前記に同じ。 $R^{105'}$ は $R^{105}$ と同様のものを意味する。〕を意味するものである請求項2記載の化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

【請求項8】  $R^{105}$ または $R^{105'}$ のどちらか一方がハロゲン原子またはエチニル基を意味するものである請求項7に記載の化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

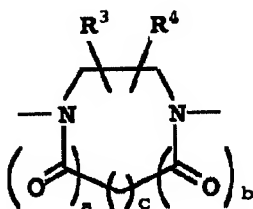
【請求項9】  $Q^1$ が置換基を有することもあるチエノピリジル基、置換基を有することもあるテトラヒドロチエノピリジル基、置換基を有することもあるチアゾロピリジル基、置換基を有することもあるテトラヒドロチア

ゾロピリジル基、置換基を有することもあるチアゾロピリダジニル基、置換基を有することもあるテトラヒドロチアゾロピリダジニル基、置換基を有することもあるピラノチアゾリル基、置換基を有することもあるジヒドロピラノチアゾリル基、置換基を有することもあるフロピリジル基、置換基を有することもあるテトラヒドロフロピリジル基、置換基を有することもあるオキサゾロピリジル基、置換基を有することもあるテトラヒドロオキサゾロピリジル基、置換基を有することもあるオキサゾロピリダジニル基または置換基を有することもあるテトラヒドロオキサゾロピリダジニル基を意味するものである請求項1～請求項8に記載のスルホニル誘導体、その塩およびそれらの溶媒和物。

【請求項10】  $Q^2$ が単結合、フェニレン基、シクロヘキシレン基またはシクロヘキセニレン基を意味するものである請求項1～請求項9のいずれか1項に記載のスルホニル誘導体、その塩およびそれらの溶媒和物。

【請求項11】  $Q^3$ が基

【化15】



【基中、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $a$ 、 $b$ および $c$ は前記に同じ。】を意味するものである請求項1～請求項10のいずれか1項に記載の化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

【請求項12】  $T^1$ がカルボニル基または基-CH( $R^{13}$ )-（基中、 $R^{13}$ は前記に同じ。）を意味するものである請求項1～請求項11のいずれか1項に記載の化合物、その塩およびそれらの溶媒和物。

【請求項13】 請求項1～請求項12のいずれか1項に記載の化合物、その塩またはそれらの溶媒和物を有効成分とする医薬。

【請求項14】 請求項1～請求項12のいずれか1項に記載の化合物、その塩またはそれらの溶媒和物を有効成分とする活性化血液凝固第X因子阻害剤。

【請求項15】 請求項1～請求項12のいずれか1項に記載の化合物、その塩またはそれらの溶媒和物を有効成分とする血液凝固抑制剤。

【請求項16】 請求項1～請求項12のいずれか1項に記載の化合物、その塩またはそれらの溶媒和物を有効成分とする血栓または塞栓の予防および/または治療剤。

【請求項17】 請求項1～請求項12のいずれか1項に記載の化合物、その塩またはそれらの溶媒和物を有効成分とする脳梗塞、脳塞栓、心筋梗塞、肺梗塞、肺塞栓、バジュー病、深部静脈血栓症、汎発性血管内凝固

症候群、人工弁置換後の血栓形成、血行再建後の再開塞、体外循環時の血栓形成または採血時の血液凝固の予防および/または治療剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、活性化血液凝固第X因子（以下、 $FXa$ と略す）を阻害して強力な抗凝固作用を示す経口投与も可能な新規な化合物（スルホニル誘導体）、その塩またはそれらを有効成分として含有する血液凝固抑制剤または血栓もしくは塞栓の予防および/または治療剤に関するものである。

【0002】

【従来の技術】不安定狭心症、脳梗塞、脳塞栓、心筋梗塞、肺梗塞、肺塞栓、バジュー病、深部静脈血栓症、汎発性血管内凝固症候群、人工弁置換後の血栓形成、血行再建後の再開塞および体外循環時の血栓形成は血液凝固能の亢進が重要な要因の一つであることから、用量反応性に優れ、持続性があり、出血の危険が低く、副作用の少ない、経口投与でも直ちに十分な効果が得られる優れた抗凝固薬が求められている（トロンボシス リサーチ；Thrombosis Research、68巻、507-512ページ、1992年）。

【0003】様々な作用機作に基づく抗凝固薬の研究の中から、 $FXa$ 阻害薬は優れた抗凝固薬となる可能性が示唆されている。血液凝固系は多段階の酵素反応による増幅過程を経て大量のトロンビンが産生され、不溶性のフィブリンを生成する一連の反応である。内因系においては接触因子の活性化に引き続き多段階の反応の後に、活性化第VII因子、カルシウムイオンの存在下にリン脂質膜上で活性化第IX因子が第X因子を活性化する。また、外因系においては組織因子の存在下に活性化VII因子が第X因子を活性化する。即ち、凝固系の中での第X因子の $FXa$ への活性化がトロンビン生成において必須の反応である。両系において活性化された第X因子（ $FXa$ ）はプロトロンビンを限定分解しトロンビンを生成する。生成したトロンビンは上流の凝固因子を活性化するため、トロンビンの生成はさらに増幅される。上記のように $FXa$ よりも上位の凝固系は内因系、外因系に分かれるため、 $FXa$ よりも上位の凝固系酵素を阻害したのでは $FXa$ の産生を十分に抑制し得ず、結果としてトロンビンを産生してしまうことになる。また、凝固系は自己増幅反応であることから、生成したトロンビンを阻害するよりも上位に位置する $FXa$ の阻害により効率良く凝固系の抑制が達成され得る（トロンボシス リサーチ；Thrombosis Research、15巻、617-629ページ、1979年）。

【0004】 $FXa$ 阻害薬の優れるもう一つの点は、血栓モデルで有効な用量と実験的出血モデルでの出血時間を延長させる用量との乖離の大きいことことであり、この実験結果より $FXa$ 阻害薬は出血の危険の少ない抗凝

固薬であると考えられる。

【0005】FXa阻害薬として様々な化合物が報告されているが、一般にアンチトロンビンIIIやアンチトロンビンIII依存性のペントサッカライドなどは、生体内で血栓形成に実際の役割を果たしているプロトロンビナーゼ複合体を阻害出来ないことが知られ（トロンボシス リサーチ; Thrombosis Research、68巻、507-512ページ、1992年、ジャーナル オブ クリニカル インベスティゲーション; Journal of Clinical Investigation、71巻、1383-1389ページ、1983年、メビオ; Mebio、8月号、92-97ページ）、さらに経口投与では有効性を示さない。吸血動物であるダニやヒルより単離されたチックアンチコアギュラントペプチド（TAP）（サイエンス; Science、248巻、593-596ページ、1990年。）およびアンチスタシン（AST）（ジャーナル オブ バイオロジカル ケミストリー; Journal of Biological Chemistry、263巻、10162-10167ページ、1988年）もFXaを阻害し静脈血栓モデルから動脈血栓モデルまで抗血栓効果を示すが、これらは高分子のペプチドであり経口投与では無効である。この様な観点から、アンチトロンビンIII非依存性に凝固因子を直接阻害する低分子のFXa阻害薬の開発が行われてきた。

#### 【0006】

【発明が解決しようとする課題】本発明は、FXa阻害作用が強く、経口投与で速やかに十分且つ持続的な抗血栓効果を得られる副作用の少ない、優れた抗凝固薬としての新規なスルホニル誘導体、その塩およびそれらの溶媒和物を提供する。

#### 【0007】

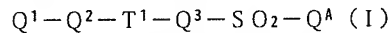
【課題を解決するための手段】上記実状に鑑み、本発明者らは、新規な抗FXa阻害剤の合成ならびに薬理作用の検討を鋭意実施した結果、新規のスルホニル誘導体、その塩またはそれらの溶媒和物が、強いFXa阻害作用ならびに強い抗凝固作用を示し、経口投与においても強く即効的かつ持続的にFXaを阻害し、強力な抗凝固作用、抗血栓作用を示し安全性も高く、血栓・塞栓に基づく

く種々の疾病の予防並びに治療薬として有用であることを見だし本発明を完成した。

#### 【0008】

【発明の実施の形態】本発明は、以下の一般式（I）で表される化合物、その塩およびそれらの溶媒和物に関する。

#### 【0009】一般式（I）



【式中、Q<sup>1</sup>は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基を意味する。

【0010】Q<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、硫黄原子、直鎖状もしくは分枝状の炭素数1～6のアルキレン基、直鎖状もしくは分枝状の炭素数2～6のアルケニレン基、直鎖状もしくは分枝状の炭素数2～6のアルキニレン基、基-N(R<sup>1</sup>)-CO-

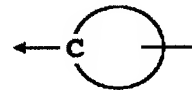
（基中、R<sup>1</sup>は水素原子またはアルキル基を意味する。）、

20 基-N(R<sup>2</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-

（基中、R<sup>2</sup>は水素原子またはアルキル基を意味し、mは0～6の整数を意味する。）、または基

#### 【0011】

#### 【化16】

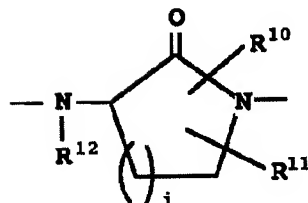
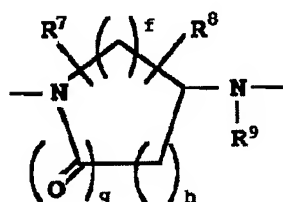
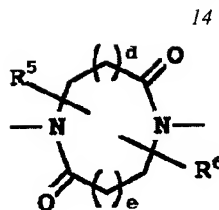
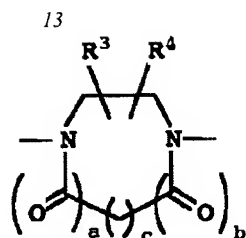


【0012】（この基は、置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基、置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基、または置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基を意味する。←Cはこの基の炭素原子がQ<sup>1</sup>と結合することを示す。）を意味する。

【0013】Q<sup>3</sup>は以下のいずれかの基を意味する。

#### 【0014】

#### 【化17】



【0015】（これらの基中、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^{10}$ および $R^{11}$ が結合する炭素原子が窒素原子に隣り合わないときは、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、アルキル基、アルコキシル基、アルコキシアルキル基、アルコキシアルキルオキシ基、ヒドロキシアルキル基、ヒドロキシアルキルオキシ基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、ホルミル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルスルホニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシル基、カルボキシアルキル基、カルボキシアルキルオキシ基カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキルスルホニルアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキルオキシ基、アルコキシカルボニルアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキルスルホニル基、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルキルスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に

置換基を1個有することもあるアリールスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキル基、シアノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルコキシアルキルアミノカルボニルアルキル基、アルキルカルボニルオキシアルキル基、または基 $A^1-B^1$ （基中、 $A^1$ は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味する。 $B^1$ は単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、基 $-O-C_1-C_6$ アルキレン基、基 $-COO-C_1-C_6$ アルキレン基、基 $-NHCO-$ または基 $-NHCO-C_1-C_6$ アルキレン基を意味する。）を意味する。

【0016】また、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^{10}$ および $R^{11}$ が結合する炭素原子が窒素原子に隣り合うときはそれぞれ独立して、水素原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、ホルミル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルスルホニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシル基、カルボキシアルキル基、カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキルスルホニルアルキル基、アルコキシアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキルスルホニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1

個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルキルスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアリールスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキル基、シアノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルコキシアルキルアミノカルボニルアルキル基、アルキルカルボニルオキシアルキル基、または基 $A^2-B^2-$ (基中、 $A^2$ は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の複素環式基を意味する。 $B^2$ は単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、基 $-O-C_1\sim C_6$ アルキレン基、基 $-COO-C_1\sim C_6$ アルキレン基、基 $-NHCO-$ または基 $-NHCO-C_1\sim C_6$ アルキレン基を意味する。)を意味する。

【0017】また、 $R^3$ および $R^4$ 、 $R^5$ および $R^6$ 、 $R^7$ および $R^8$ 、 $R^{10}$ および $R^{11}$ は環を構成する炭素原子とともに一緒になって置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~7員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~7員の複素環式基を意味してもよく、

【0018】 $R^9$ および $R^{12}$ はそれぞれ独立して、水素原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、アルコキシル基、アルコキシアルキル基、アルコキシアルキルカルボニル基、アルコキシアルキルスルホニル基、ホルミル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシアルキル基、カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキルスルホニルアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキルスルホニル基、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルオキシカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有するこ

ともあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルオキシアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルキルスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアリールスルホニルアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキル基、シアノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルコキシアルキルアミノカルボニルアルキル基、またはアルキルカルボニルオキシアルキル基を意味する。

【0019】また、 $R^9$ は $R^7$ または $R^8$ と一緒に環を構成する炭素原子と $R^9$ が結合する窒素原子とともに、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~7員の複素環式基を意味してもよい。

【0020】また、 $R^{12}$ は $R^{10}$ または $R^{11}$ と一緒に環を構成する炭素原子と $R^{12}$ が結合する窒素原子とともに、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~7員の複素環式基を意味してもよい。

【0021】a、b、d、eおよびgはそれぞれ独立して、0または1の整数を意味する。cは0から3の整数を意味する。f、hおよびiはそれぞれ独立して、1から3の整数を意味する。ただし、aとbとcの和は2または3の整数を意味し、dおよびeの和は0または1の整数を意味し、fとgとhの和は3から5の整数を意味する。

【0022】 $Q^A$ は置換基を有することもあるアリールアルケニル基、置換基を有することもあるヘテロアリールアルケニル基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基、基 $A_r-C(H)=N-$ (基中、 $A_r$ は置換基を有することもあるアリール基を意味する。)または基 $He_t-C(H)=N-$ (基中、 $He_t$ は置換基を有することもあるヘテロアリール基を意味する。)を意味する。

【0023】 $T^1$ はカルボニル基、基 $-CH(R^{13})-$

(基中、 $R^{13}$ は水素原子、アルキル基、水酸基が保護されることのあるヒドロキシアルキル基、アルコキシアルキル基、カルボキシアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アリール基、アラールキル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基またはアミノ基部分に置換基(保護基)を有することもあるアミノアルキル基を意味する。)

基 $-C(=NOR^{14})-$  または 基 $-C(=N-NHR^{14'})-$

(基中、 $R^{14}$ および $R^{14'}$ はそれぞれ水素原子、アルキル基、カルボキシアルキル基、アルコキシカルボニル基、アリール基、アラールキル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基またはアミノ基部分に置換基を

有することもあるアミノアルキル基を意味する。)を意味する。]で表されるスルホニル誘導体、その塩およびそれらの溶媒和物。

【0024】以下に、一般式(I)で表される本発明のスルホニル誘導体における置換基について説明する。

<基 $Q^A$ について>基 $Q^A$ は置換基を有することもあるアリールアルケニル基、置換基を有することもあるヘテロアリールアルケニル基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基、基 $Ar-C(H)=N-$ (基中、 $Ar$ は置換基を有することもあるアリール基を意味する。)または基 $Het-C(H)=N-$ (基中、 $Het$ は置換基を有することもあるヘテロアリール基を意味する。)を意味する。

【0025】基 $Q^A$ において、置換基を有することもあるアリールアルケニル基は、アリール基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2~6のアルケニレン基とで構成する基を意味する。アリール基としては、例えば、フェニル基、ナフチル基、アントリル基、フェナントリル基等を挙げることができ、アリールアルケニル基としては、例えば、フェニルエテニル基等を挙げることができる。

【0026】置換基を有することもあるヘテロアリールアルケニル基は、ヘテロアリール基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2~6のアルケニレン基とで構成する基を意味する。ヘテロアリール基は、少なくとも1個の異原子を含む芳香族性の1価の基を意味し、例えば、ピリジル基、フリル基、チエニル基等を挙げることができる。ヘテロアリールアルケニル基としては、例えば、ピリジエテニル基等を挙げることができる。

【0027】置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基、飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基は、①置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の環状炭化水素基が縮合したもの、②置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の環状炭化水素基と置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の複素環式基とが縮合したもの、③置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の複素環式基が縮合したものを意味する。

【0028】飽和もしくは不飽和の5~6員の環状炭化水素基としては、例えば、シクロペンチル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、シクロヘキサジエニル基およびフェニル基等を挙げることができる。なお、シクロペンテニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0029】飽和もしくは不飽和の5~6員の複素環式基は、少なくとも1個の異原子を含む環式基であり、異原子としては酸素原子、窒素原子および硫黄原子等を挙げることができる。飽和もしくは不飽和の5~6員の複

素環式基としては、例えば、フリル基、ピロリル基、チエニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、オキサゾリニル基、チアゾリル基、チアゾリニル基、オキサトリアゾリル基、チアジアゾリル基、フラザニル基、ピラニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、オキサジニル基、オキサジアジニル基、モルホリニル基、チアジニル基、チアジアジニル基、チオモルホリニル基、テトラゾリル基、トリアゾリル基およびトリアジニル基等を挙げることができる。なお、ピラニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0030】したがって、例えば、①のものとしては、インデニル基、インダニル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、アントリル基、フェナントリル基等を挙げることができる。②のものとしては、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、インドリル基、インドリニル基、キノリル基、ベンゾジアジニル基、テトラヒドロイソキノリル基、ベンゾチアゾリル基、テトラヒドロベンゾチアゾリル基、イソインドリル基等を挙げることができる。③のものとしては、ナフチリジニル基、テトラヒドロチエノピリジル基、テトラヒドロチアゾロピリジル基、テトラヒドロピリドピリジル基、チアゾロピリダジニル基、テトラヒドロチアゾロピリダジニル基、ピロロピリジル基、テトラヒドロピロロピリジル基、ジヒドロピリドキナゾリル基、ピリドピリミジニル基、テトラヒドロピリドピリミジニル基、ピラノチアゾリル基、ジヒドロピラノチアゾリル基、フロピリジル基、テトラヒドロフロピリジル基、オキサゾロピリジル基、テトラヒドロオキサゾロピリジル基、オキサゾロピリダジニル基、テトラヒドロオキサゾロピリダジニル基等を挙げることができる。

【0031】基 $Ar-C(H)=N-$ (基中、 $Ar$ は置換基を有することもあるアリール基を意味する。)におけるアリール基としては、先に説明したものと同様のものを意味し、基 $Ar-C(H)=N-$ としては、置換基を有することもあるフェニル基と基 $-C(H)=N-$ とで構成される基等を意味する。

【0032】また、基 $Het-C(H)=N-$ (基中、 $Het$ は置換基を有することもあるヘテロアリール基を意味する。)におけるヘテロアリール基としては、先に説明したものと同様のものを意味し、基 $Het-C(H)=N-$ としては、置換基を有することもあるピリジル基と基 $Het-C(H)=N-$ とで構成される基等を意味する。

【0033】アリールアルケニル基、ヘテロアリールアルケニル基、飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基、飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基、基 $Ar-C(H)=N-$ 、基 $Het-C(H)=N-$ は、それぞれ置換基を1個~2個有することもあり、置換基として

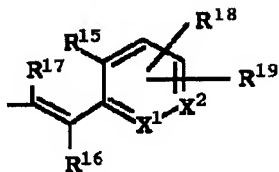
は、水酸基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子、ハロゲン原子が1個から3個置換したハロゲノメチル基、アミノ基、シアノ基、アミノメチル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基

(例えば、メチル基、エチル基など)、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルコキシル基(例えば、メトキシル基、エトキシル基など)、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2～7のアルコキシカルボニルアミジノ基(例えば、メトキシカルボニルアミジノ基、エトキシカルボニルアミジノ基など)、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2～6のアルケニル基(例えば、ビニル基、アリル基など)、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2～6のアルキニル基(例えば、エチニル基、プロピニル基など)、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2～6のアルコキシカルボニル基(例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基など)およびアミノカルボニル基等を挙げることができる。

【0034】基 $Q^A$ は、より具体的には、以下のいずれかの基を示すものである。

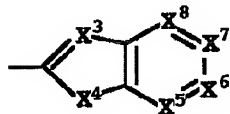
【0035】

【化18】



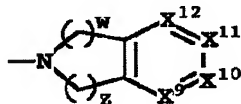
【0036】

【化19】



【0037】

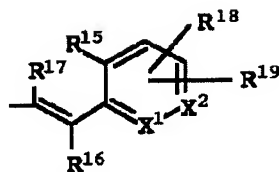
【化20】



【0038】以下に、これらの基における置換基について説明を加える。基

【0039】

【化21】



【0040】における $R^{15}$ は、水素原子、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシル基、アルコキシアルキル基、カルボキシル基、カルボキシアルキル基、アルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルキルカルボニルオキシ基、または基 $A^3-B^3$  (基中、 $A^3$ は置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味する。 $B^3$ は単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、カルボニルアルキルオキシ基、またはアルキレンカルボニルオキシ基を意味する。)を意味する。

【0041】 $R^{15}$ において、ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子等を挙げることができる。

【0042】アルキル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、イソプロピル基、シクロプロピル基等を挙げることができる。

【0043】ヒドロキシアルキル基は、水酸基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、アルキレン基としては、メチレン基、エチレン基、トリメチレン基、プロピレン基、シクロヘキシレン基等を挙げることができる。ヒドロキシアルキル基としては、例えば、ヒドロキシメチル基、ヒドロキシエチル基等を挙げることができる。

【0044】アルコキシル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基と酸素原子で構成する基を意味し、例えば、メトキシル基、エトキシル基、イソプロポキシル基等を挙げることができる。

【0045】アルコキシアルキル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルコキシル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、メトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシメチル基等を挙げることができる。

【0046】カルボキシアルキル基は、カルボキシル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、カルボキシメチル基、カルボキシエチル基等を挙げることができる。

【0047】アルキルカルボニル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、メチルカルボニル基、エチルカルボニル基等を挙げることができる。

【0048】アルコキシカルボニル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルコキシル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等を挙げることがで



きる。

【0049】アルコシカルボニルアルキル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2～7のアルコシカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、メトキシカルボニルエチル基、エトキシカルボニルメチル基等を挙げることができる。

【0050】アルキルカルボニルオキシ基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2～7のアルキルカルボニル基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、メチルカルボニルオキシ基、エチルカルボニルオキシ基、イソプロピルカルボニルオキシ基等を挙げることができる。

【0051】基 $A^3-B^3$ において、 $A^3$ は置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味する。

【0052】したがって、 $A^3$ が置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基を意味する場合、 $B^3$ が単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、カルボニルアルキルオキシ基またはアルキレンカルボニルオキシ基を意味することから、基 $A^3-B^3$ は、例えば、以下の群(A)に示すような基等を意味するものである。

【0053】群(A)：置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニルオキシ基等。

【0054】以下に、群(A)で示した基について説明する。

【0055】アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基は、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基とカルボニル基とで構成する基を意味する。

【0056】アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基は、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、アミノアルキル基としては、例えば、アミノメチル基、アミノエチル基等を挙げることができる。

【0057】アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基は、上述の置換基を有することもあるアミノカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、アミノカルボニルアルキル基としては、例えば、アミノカルボニルメチル基、アミノカルボニルエチル基を挙げることができる。

【0058】アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルオキシ基は、上述の置換基を有することもあるアミノカルボニルアルキル基と酸素原子とで構成する基を意味し、アミノカルボニルアルキルオキシ基としては、例えば、アミノカルボニルメトキシ基、アミノカルボニルエトキシ基を意味する。

【0059】アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基は、上述の置換基を有することもあるアミノアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、アミノアルキルカルボニル基としては、例えば、アミノメチルカルボニル基、アミノエチルカルボニル基等を挙げることができる。アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニルオキシ基は、上述の置換基を有することもあるアミノアルキルカルボニル基と酸素原子とで構成する基を意味し、アミノアルキルカルボニルオキシ基としては、例えば、アミノメチルカルボニルオキシ基、アミノエチルカルボニルオキシ基等を挙げることができる。

【0060】なお、アミノ基(部分)に置換し得る置換基としては、例えば、以下の群(1)のものを挙げることができる。

【0061】群(1)：アルキル基、アルケニル基、ハロゲノアルキル基、ハロゲノアルケニル基、ヒドロキシアルキル基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、アルコキシル基、アルコキシアルキル基、アルコキシアルキルカルボニル基、アルコキシアルキルスルホニル基、ホルミル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシアルキル基、カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキルスルホニルアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキルスルホニル基、トリフルオロメチルスルフォニルオキシアルケニル基、および基 $a^3-b^3$ —

(基中、 $a^3$ はハロゲン原子、水酸基、アミノ基、アルコキシル基、アルキル基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、アルコキシカルボニル基およびアミノカルボ

ニル基からなる群より選ばれる置換基を1個～3個有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味する。 $b^3$ は単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、カルボニルアルキルオキシ基、アルキレンカルボニルオキシ基、アルキレンアミノカルボニル基、アルキレンアミノカルボニルアルキル基、アルキレンアミノスルホニル基またはアルキレンアミノスルホニルアルキル基を意味する。)

【0062】ここで、群(1)における、アミノ基(部分)に置換し得る置換基について説明を加える。

【0063】アルキル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のものを意味する。例えば、メチル基、エチル基、イソプロピル基、シクロプロピル基等を挙げることができる。

【0064】アルケニル基は、直鎖状、分枝状または環状の炭素数2～6のアルケニル基を意味し、例えば、ビニル基、アリル基等を挙げることができる。

【0065】ハロゲノアルキル基は、ハロゲン原子と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、クロロメチル基、プロモエチル基等を挙げることができる。

【0066】ハロゲノアルケニル基とは、ハロゲン原子と直鎖状もしくは分枝状の炭素数2～6のアルケニレン基とで構成する基を意味し、例えば、クロロビニル基、プロモアリル基等を挙げることができる。なお、二重結合の位置は特に限定されるものではない。

【0067】ヒドロキシアルキル基は、水酸基と直鎖状、分枝状、環状の炭素数2～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、ヒドロキシエチル基、ヒドロキシプロピル基等を挙げることができる。

【0068】ヒドロキシアルキルカルボニル基は、上述のヒドロキシアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、ヒドロキシメチルカルボニル基、ヒドロキシエチルカルボニル基等を挙げることができる。

【0069】ヒドロキシアルキルスルホニル基は、上述のヒドロキシアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、例えば、ヒドロキシメチルスルホニル基、ヒドロキシエチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0070】アルコキシル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のものを意味する。例えば、メトキシル基、エトキシル基等を挙げることができる。

【0071】アルコシアルキル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルコキシル基と直鎖状、分枝状、環状の炭素数2～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メトキシプロピル基等を挙げることができる。

【0072】アルコシアルキルカルボニル基は、上述のアルコシアルキル基とカルボニル基とで構成する基

を意味し、例えば、メトキシエチルカルボニル基、エトキシメチルカルボニル基等を挙げることができる。

【0073】アルコシアルキルスルホニル基は、上述のアルコシアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、例えば、メトキシメチルスルホニル基、エトキシメチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0074】ホルミルアルキル基は、ホルミル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、ホルミルメチル基、ホルミルエチル基等を挙げることができる。

【0075】ホルミルアルキルカルボニル基は、上述のホルミルアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、ホルミルメチルカルボニル基、ホルミルエチルカルボニル基等を挙げることができる。

【0076】ホルミルアルキルスルホニル基は、上述のホルミルアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、例えば、ホルミルメチルスルホニル基、ホルミルエチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0077】アルキルカルボニル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、メチルカルボニル基、エチルカルボニル基等を挙げることができる。

【0078】アルキルカルボニルアルキル基は、上述のアルキルカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、メチルカルボニルメチル基、エチルカルボニルメチル基等を挙げることができる。

【0079】アルキルスルホニル基は、上述のアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0080】アルキルスルホニルアルキル基は、上述のアルキルスルホニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、メチルスルホニルメチル基、エチルスルホニルメチル基等を挙げることができる。

【0081】カルボキシアルキル基は、カルボキシル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味する。例えば、カルボキシメチル基、カルボキシエチル基等を挙げることができる。

【0082】カルボキシアルキルカルボニル基は、上述のカルボキシアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、カルボキシメチルカルボニル基、カルボキシエチルカルボニル基等を挙げることができる。

【0083】カルボキシアルキルスルホニル基は、上述のカルボキシアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、例えば、カルボキシメチルスルホニル基、カルボキシエチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0084】カルボキシアルキルカルボニルアルキル基

は、上述のカルボキシアルキルカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、カルボキシメチルカルボニルメチル基、カルボキシエチルカルボニルメチル基等を挙げることができる。

【0085】カルボキシアルキルスルホニルアルキル基は、上述のカルボキシアルキルスルホニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、カルボキシメチルスルホニルメチル基、カルボキシエチルスルホニルメチル基等を挙げることができる。

【0086】アルコキシカルボニル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルコキシル基とカルボニル基とで構成する基を意味する。例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0087】アルコキシカルボニルアルキル基は、上述のアルコキシカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味する。例えば、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基等を挙げることができる。

【0088】アルコキシカルボニルアルキルカルボニル基は、上述のアルコキシカルボニルアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、メトキシカルボニルエチルカルボニル基、エトキシカルボニルメチルカルボニル基等を意味する。

【0089】アルコキシカルボニルアルキルスルホニル基は、上述のアルコキシカルボニルアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、例えば、メトキシカルボニルエチルスルホニル基、エトキシカルボニルメチルスルホニル基等を意味する。

【0090】トリフルオロメチルスルフォニルオキシアルケニル基は、トリフルオロメチルスルフォニルオキシ基と直鎖状もしくは分枝状の炭素数2～6のアルケニレン基とで構成する基を意味し、例えば、トリフルオロメチルスルフォニルオキシビニル基、トリフルオロメチルスルフォニルオキシアリル基等を挙げることができる。

【0091】基  $a^3-b^3$  における、 $a^3$  はハロゲン原子等の置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味するが、ここで、飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基としては、例えば、シクロペンチル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、シクロヘキサジエニル基およびフェニル基等を挙げることができる。なお、シクロペンテニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0092】飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基は、少なくとも1個の異原子を含む環式基であり、異原子としては酸素原子、窒素原子および硫黄原子等を挙

げることができる。飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基としては、例えば、フリル基、ピロリル基、チエニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリニル基、オキサゾリル基、オキサゾリニル基、チアゾリル基、チアゾリニル基、オキサトリアゾリル基、チアアジアゾリル基、フラザニル基、ピラニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、オキサジニル基、オキサジアジニル基、モルホリニル基、チアジニル基、チアアジアジニル基、チオモルホリニル基、テトラゾリル基、トリアゾリル基およびトリアジニル基等を挙げることができる。なお、ピラニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0093】 $b^3$  は単結合やカルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、カルボニルアルキルオキシ基、アルキレンカルボニルオキシ基、アルキレンアミノカルボニル基、アルキレンアミノカルボニルアルキル基、アルキレンアミノスルホニル基またはアルキレンアミノスルホニルアルキル基の2個の基を意味するが、アルキレン基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のものを意味する。

【0094】カルボニルアルキル基は、カルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、カルボニルメチル基、カルボニルエチル基等を挙げることができる。

【0095】カルボニルアルキルオキシ基は、上述のカルボニルアルキル基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、カルボニルメトキシ基、カルボニルエトキシ基等を挙げることができる。

【0096】アルキレンカルボニルオキシ基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とカルボニル基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、メチレンカルボニルオキシ基、エチレンカルボニルオキシ基等を挙げることができる。

【0097】アルキレンアミノカルボニル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とイミノ基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、メチレンアミノカルボニル基、エチレンアミノカルボニル基等を挙げることができる。

【0098】アルキレンアミノカルボニルアルキル基は、上述のアルキレンアミノカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、メチレンアミノカルボニルメチル基、エチレンアミノカルボニルメチル基等を挙げることができる。

【0099】アルキレンアミノスルホニル基は、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とイミノ基とスルホニル基とで構成する基を意味し、例えば、メチレンアミノスルホニル基、エチレンアミノスルホニル基等を挙げることができる。

【0100】また、アルキレンアミノスルホニルアルキル基とは、上述のアルキレンアミノスルホニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、メチレンアミノスルホニルメチル基、エチレンアミノスルホニルメチル基等を挙げることができる。

【0101】上述の $a^3$ としての飽和もしくは不飽和の5～6員の置換基を有することもある環状炭化水素基または飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基に置換し得る置換基について説明を加える。ハロゲン原子、アルコキシ基、アルキル基、アルコシカルボニル基およびアミノカルボニル基は、先に説明したものと同様のものを意味する。

【0102】基 $a^3-b^3$ としては、 $a^3$ と $b^3$ の組み合わせにより種々のものが存在し、例えば、以下のような基を挙げることができる。

【0103】置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基とカルボニル基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基とアルキレン基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基とカルボニルアルキル基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基とカルボニルアルキルオキシ基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基とアルキレンカルボニルオキシ基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基とアルキレンアミノカルボニル基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基とアルキレンアミノカルボニルアルキル基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基とアルキレンアミノスルホニル基とで構成する基、および置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基とアルキレンアミノスルホニルアルキル基とで構成する基等。

【0104】アミノ基（部分）に置換し得る置換基としては、上述の群（1）のもののほかに以下の群（2）のものをも挙げることができる。

【0105】群（2）：上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基

を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルカルボニル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルスルホニル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルスルホニル基、アミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキルカルボニル基、およびアミノ基部分に上述の群（1）から選ばれる置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキルスルホニル基。

【0106】以下に、群（2）の置換基について説明を加える。

【0107】この群（2）におけるアミノアルキル基、アミノカルボニル基、アミノカルボニルアルキル基およびアミノアルキルカルボニル基は、先に説明したものと同じものを意味する。

【0108】アミノ基部分に置換基を有することもあるアミノアルキル基とは、先に説明した置換基を有することもあるアミノ基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数2～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、アミノアルキル基としては、例えば、アミノエチル基、アミノプロピル基等を挙げることができる。

【0109】アミノ基部分に置換基を有することもあるアミノカルボニルアルキルカルボニル基とは、先に説明した置換基を有することもあるアミノカルボニルアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、アミノカルボニルアルキルカルボニル基としては、例えば、アミノカルボニルメチルカルボニル基、アミノカルボニルエチルカルボニル基等を挙げることができる。

【0110】アミノ基部分に置換基を有することもあるアミノカルボニルアルキルスルホニル基とは、先に説明した置換基を有することもあるアミノカルボニルアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、アミノカルボニルアルキルスルホニル基としては、例えば、アミノカルボニルメチルスルホニル基、アミノカルボニルエチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0111】アミノ基部分に置換基を有することもあるアミノスルホニル基とは、先に説明した置換基を有することもあるアミノ基とスルホニル基とで構成する基を意味する。

【0112】アミノ基部分に置換基を有することもあるアミノスルホニルアルキル基とは、上述の置換基を有す

ることもあるアミノスルホニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数 1~6 のアルキレン基とで構成する基を意味し、アミノスルホニルアルキル基としては、例えば、アミノスルホニルメチル基、アミノスルホニルエチル基等を挙げることができる。

【0113】アミノ基部分に置換基を有することもあるアミノアルキルスルホニル基とは、先に説明した置換基を有することもあるアミノアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、アミノアルキルスルホニル基としては、例えば、アミノメチルスルホニル基、アミノエチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0114】アミノ基部分に置換基を有することもあるアミノスルホニルアルキルカルボニル基とは、上述の置換基を有することもあるアミノスルホニルアルキル基とカルボニル基とで構成する基を意味し、アミノスルホニルアルキルカルボニル基としては、例えば、アミノスルホニルメチルカルボニル基、アミノスルホニルエチルカルボニル基等を挙げることができる。

【0115】アミノ基部分に置換基を有することもあるアミノスルホニルアルキルスルホニル基とは、上述の置換基を有することもあるアミノスルホニルアルキル基とスルホニル基とで構成する基を意味し、アミノスルホニルアルキルスルホニル基としては、例えば、アミノスルホニルメチルスルホニル基、アミノスルホニルエチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0116】また、 $A^3$ は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基をも意味するが、ここで、飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基としては、例えば、シクロペンチル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、シクロヘキサジエニル基およびフェニル基等を挙げることができる。なお、シクロペンテニル基のように複数の構造異性性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0117】飽和もしくは不飽和の 5~6 員の複素環式基とは、少なくとも 1 個の異原子を含む環式基であり、異原子としては酸素原子、窒素原子および硫黄原子等を挙げることができる。飽和もしくは不飽和の 5~6 員の複素環式基としては、例えば、フリル基、ピロリル基、チエニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアゾリル基、オキサトリアゾリル基、チアジアゾリル基、フラザニル基、ピラニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、オキサジニル基、オキサジアジニル基、モルホリニル基、チアジニル基、チアジアジニル基、チオモルホリニル基、テトラゾリル基、トリアゾリル基およびトリアジニル基等を挙げることができる。なお、ピラニル基のように複数の構造異性性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0118】 $A^3$ が置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基を意味する場合、 $B^3$ が単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、カルボニルアルキルオキシ基またはアルキレンカルボニルオキシ基を意味することから、基  $A^3-B^3$  は、例えば、以下の群 (B) に示すような基等を意味するものである。

【0119】群 (B) : 置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とカルボニル基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とアルキレン基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とカルボニルとアルキレン基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とカルボニル基と酸素原子とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とアルキレン基とカルボニル基とで構成する基、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とアルキレン基とで構成する基等。

【0120】以下に、群 (B) で示した基について説明する。

【0121】置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とカルボニル基とで構成する基における、環状炭化水素基とカルボニル基とで構成する基としては、例えば、シクロペンチルカルボニル基、フェニルカルボニル基等を挙げることができる。また、複素環式基とカルボニル基とで構成する基としては、例えば、フリルカルボニル基、チエニルカルボニル基、ピリジルカルボニル基等を挙げることができる。

【0122】置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とアルキレン基とで構成する基における、環状炭化水素基とアルキレン基とで構成する基とは、上述の環状炭化水素基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数 1~6 のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、シクロヘキシルメチル基、ベンジル基等を挙げることができる。また、複素環式基とアルキレン基とで構成する基とは、上述の複素環式基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数 1~6 のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、フリルメチル基、チエニルエチル基、ピリジルプロピル基等を挙げることができる。

【0123】置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の 5~6 員の環状炭化水素基または複素環式基とカ

ルボニル基とアルキレン基とで構成する基における、環状炭化水素基とカルボニル基とアルキレン基とで構成する基とは、上述の環状炭化水素基とカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、シクロペンタジエニルカルボニルメチル基、フェニルカルボニルエチル基等を挙げることができる。また、複素環式基とカルボニル基とアルキレン基とで構成する基とは、上述の複素環式基とカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、フリルカルボニルメチル基、チエニルカルボニルエチル基、ピリジルカルボニルプロピル基等を挙げることができる。

【0124】置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または複素環式基とカルボニル基とアルキレン基と酸素原子とで構成する基における、環状炭化水素基とカルボニル基とアルキレン基と酸素原子とで構成する基とは、上述の環状炭化水素基とカルボニル基とアルキレン基とで構成する基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、シクロペンチルカルボニルメトキシ基、フェニルカルボニルエトキシ基等を挙げることができる。また、複素環式基とカルボニル基とアルキレン基と酸素原子とで構成する基とは、上述の複素環式基とカルボニル基とアルキレン基とで構成する基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、フリルカルボニルメトキシ基、チエニルカルボニルエトキシ基、ピリジルカルボニルプロポキシ基等を挙げることができる。

【0125】置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または複素環式基とアルキレン基とカルボニル基とで構成する基における、環状炭化水素基とアルキレン基とカルボニル基とで構成する基とは、上述の環状炭化水素基とアルキレン基とで構成する基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、シクロヘキシルメチルカルボニル基、フェニルエチルカルボニル基等を挙げることができる。また、複素環式基とアルキレン基とカルボニル基とで構成する基とは、上述の複素環式基とアルキレン基とで構成する基とカルボニル基とで構成する基を意味し、例えば、フリルメチルカルボニル基、チエニルエチルカルボニル基、ピリジルプロピルカルボニル基等を挙げることができる。

【0126】置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または複素環式基とアルキレン基とカルボニル基と酸素原子とで構成する基における、環状炭化水素基とアルキレン基とカルボニル基と酸素原子とで構成する基とは、上述の環状炭化水素基とアルキレン基とカルボニル基とで構成する基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、シクロヘキサジエニルメチルカルボニルオキシ基、フェニルエチルカルボニルオキシ基等を挙げることができる。また、複素環式

基とアルキレン基とカルボニル基と酸素原子とで構成する基とは、上述の複素環式基とアルキレン基とカルボニル基とで構成する基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、フリルメチルカルボニルオキシ基、チエニルエチルカルボニルオキシ基、ピリジルプロピルカルボニルオキシ基等を挙げることができる。

【0127】なお、飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または複素環式基に、置換し得る置換基としては、以下の群(3)のものを挙げることができる。

10 なお、置換し得る置換基の数は1～3個である。

【0128】群(3)：水酸基、アルキル基、アルコキシル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、アルコキシカルボニル基、ホルミル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基、アルキルイミノ基、アミジノ基、グアニジノ基、アミノ(ヒドロキシイミノ)アルキル基、アミノ(アルコキシイミノ)アルキル基、アミノ(アリールオキシイミノ)アルキル基、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニルオキシ基、および酸素原子。

30 【0129】以下に、群(3)における飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または複素環式基に、置換し得る置換基について説明を加える。

【0130】アルキル基、アルコキシル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシアルキル基、ハロゲン原子、アルコキシカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニルオキシ基については、先に説明したものと同様のものを意味する。

50 【0131】ヘテロアリール基は、少なくとも1個の異なる原子を含む芳香族性の1価の基を意味し、例えば、ピリ



ジル基、フリル基、チエニル基等を挙げることができる。

【0132】ヘテロアリールアルキル基は、上述のヘテロアリール基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、ピリジルメチル基、フリルエチル基、チエニルメチル基等を挙げることができる。

【0133】アルキルイミノ基とは、直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基と窒素原子とで構成する2価の基を意味し、例えば、メチルイミノ基、エチルイミノ基等を挙げることができる。

【0134】アミノ（ヒドロキシイミノ）アルキル基は、アミノ基とヒドロキシイミノ基が直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基の同一の炭素原子に結合した基を意味し、例えば、アミノ（ヒドロキシイミノ）メチル基、アミノ（ヒドロキシイミノ）エチル基等を挙げることができる。

【0135】アミノ（アルコキシイミノ）アルキル基は、アミノ基とアルコキシイミノ基が直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基の同一の炭素原子に結合した基を意味する。ここで、アルコキシイミノ基とは、先に説明したアルコキシ基とイミノ基とで構成する2価の基を意味する。アミノ（アルコキシイミノ）アルキル基としては、例えば、アミノ（メトキシイミノ）メチル基、アミノ（エトキシイミノ）メチル基等を挙げることができる。

【0136】アミノ（アリールオキシイミノ）アルキル基は、アミノ基とアリールオキシイミノ基が直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基の同一の炭素原子に結合した基を意味する。ここで、アリールオキシイミノ基とは、アリール基とイミノ基とで構成する2価の基を意味する。ここで、アリール基としては、例えば、フェニル基、ナフチル基、アントリル基、フェナントリル基等を挙げることができる。アミノ（アリールオキシイミノ）アルキル基としては、例えば、アミノ（フェノキシイミノ）メチル基、アミノ（ナフチルオキシイミノ）メチル基等を挙げることができる。

【0137】アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルオキシ基は、置換基を有するアミノ基と直鎖状、分枝状、環状の炭素数2～6のアルキレン基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、アミノアルキルオキシ基としては、アミノエチルオキシ基、アミノプロピルオキシ基等を挙げることができる。なお、アミノ基部分に置換し得る基としては、先に説明したものと同様のものを挙げることができる。

【0138】なお、酸素原子が置換基となり得るのは、環状炭化水素基の場合は、ケト化合物となる場合である。また、複素環式基または2環性もしくは3環性の縮合環基の場合は、環を構成する窒素原子または硫黄原子に酸素原子が結合して、N-オキシドまたはS-オキシ

ドとなる場合と、ケト化合物となる場合である。

【0139】本発明においては、 $R^{15}$ が、 $R^{16}$ または $R^{17}$ と一緒に、炭素数1～3のアルキレン基またはアルケニレン基を意味しない場合、 $R^{15}$ としては、水素原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、基 $A^3-B^3$ 一が好ましい。

【0140】 $R^{16}$ および $R^{17}$ において、ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子等を挙げることができる。

【0141】アルキル基としては、直鎖状、分枝状あるいは環状の炭素数1～8のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、イソプロピル基、シクロプロピル基、ヘプチル基、オクチル基等を挙げることができる。

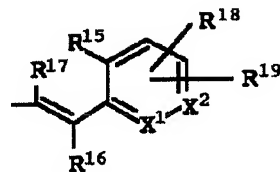
【0142】ヒドロキシアルキル基は、水酸基と直鎖状、分枝状あるいは環状の炭素数1～8のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、ヒドロキシメチル基、ヒドロキシエチル基を挙げることができる。

【0143】アルコキシアルキル基とは、上述のアルキル基と酸素原子と直鎖状、分枝状あるいは環状の炭素数1～8のアルキレン基とで構成する基を意味し、例えば、メトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシメチル基等を挙げることができる。

【0144】なお、 $R^{16}$ または $R^{17}$ は、 $R^{15}$ と一緒に、炭素数1～3のアルキレン基またはアルケニレン基を意味することがあるが、これは例えば、基

【0145】

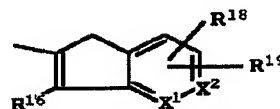
【化22】



【0146】が、以下の基等を意味するものである。

【0147】

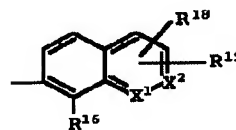
【化23】



【0148】または

【0149】

【化24】



【0150】本発明において、 $R^{16}$ または $R^{17}$ が、 $R^{15}$

と一緒にあって、炭素数1～3のアルキレン基またはアルケニレン基を意味しない場合、R<sup>16</sup>およびR<sup>17</sup>は水素原子またはアルキル基が好ましい。

【0151】本発明においては、R<sup>15</sup>とR<sup>16</sup>またはR<sup>17</sup>が一緒にあって、炭素数1～3のアルキレン基またはアルケニレン基を意味するものが好ましい。

【0152】R<sup>18</sup>およびR<sup>19</sup>はそれぞれ独立して、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、ハロゲノアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基、トリフルオロメチル基、シアノ基、アミノ基、アミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基またはアルコキシカルボニルアミジノ基を意味する（ただし、R<sup>18</sup>およびR<sup>19</sup>は同時に水素原子であることはない。）。

【0153】R<sup>18</sup>およびR<sup>19</sup>において、ハロゲン原子、ハロゲノアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、アミノアルキル基は説明したものと同様のものを意味する。

【0154】アルキルアミノアルキル基は、アミノアルキル基のアミノ基に直鎖状、分枝状または環状のアルキル基が1個もしくは2個置換したものを意味し、例えば、メチルアミノメチル基、エチルメチルアミノメチル基等を挙げることができる。

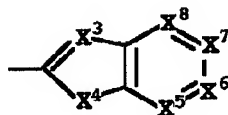
【0155】保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基は、トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、第三級ブチルジメチルシリル基、ジメチルフェニルシリル基等のアルキルシリル基が保護基として置換することもあるアルキニル基を意味する。

【0156】本発明においては、R<sup>18</sup>およびR<sup>19</sup>としては、ハロゲン原子、アルキニル基が好ましく、中でも塩素原子、臭素原子、エチニル基が好ましい。

【0157】基

【0158】

【化25】



【0159】におけるX<sup>3</sup>は、窒素原子または基=C(R<sup>100</sup>)—

(基中、R<sup>100</sup>は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシカルボニル基、アラールキルオキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、ニトロ基、保護基を有することもあるアミノ基またはアミノ基部分に保護基を有することもあるアミノアルキル基を意味する。)を意味する。

【0160】R<sup>100</sup>における、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシカルボニル基、アリールオキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アリ

ールオキシカルボニルアルキル基は、先に説明したものと同様のものを意味する。保護基を有することもあるアミノ基またはアミノ基部分に保護基を有することもあるアミノアルキル基は、通常知られた保護基を有することもあるアミノ基またはアミノアルキル基を意味する。

【0161】X<sup>4</sup>は酸素原子、硫黄原子または基—N(R<sup>101</sup>)—

(基中、R<sup>101</sup>は水素原子、アルキル基、アルコキシカルボニル基、アラールキルオキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルキルスルホニル基またはアリールスルホニル基を意味する。)を意味する。

【0162】R<sup>101</sup>における、アルキル基、アルコキシカルボニル基、アラールキルオキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルキルスルホニル基およびアリールスルホニル基は、先に説明したものと同様のものを意味する。

【0163】X<sup>5</sup>およびX<sup>8</sup>はそれぞれ独立して窒素原子または

基—C(R<sup>102</sup>)—

(基中、R<sup>102</sup>は、水素原子またはハロゲン原子を意味する。)を意味し、R<sup>102</sup>における、ハロゲン原子は先に説明したものと同様のものを意味する。

【0164】X<sup>6</sup>およびX<sup>7</sup>はそれぞれ独立して窒素原子または

基—C(R<sup>103</sup>)—

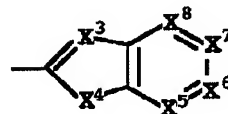
(基中、R<sup>103</sup>は、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、ハロゲノアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基、シアノ基、アミノ基、アミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基またはアルコキシカルボニルアミジノ基を意味する。)を意味する。

【0165】R<sup>103</sup>における、ハロゲン原子、ハロゲノアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基、アミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、アルコキシカルボニルアミジノ基は先に説明したものと同様のものを意味する。

【0166】基

【0167】

【化26】

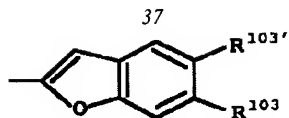


【0168】としては、

【0169】

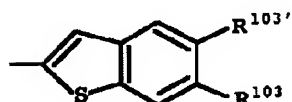
【化27】





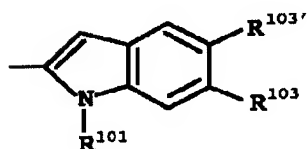
【0170】

【化28】



【0171】

【化29】



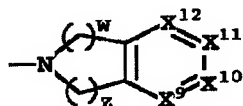
【0172】 [上記基中、 $R^{101}$ および $R^{103}$ は前記に同じ。 $R^{103'}$ は $R^{103}$ と同様のものを意味する。] のいづれかを意味する基が好ましい。

【0173】 ここで、 $R^{101}$ としては、水素原子が特に好ましい。また、 $R^{103}$ および $R^{103'}$ のどちらか一方が、ハロゲン原子、アルキニル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基、アルコキシカルボニルアミジノ基であるものが好ましく、中でもハロゲン原子、エチニル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基、メトキシカルボニルアミジノ基が特に好ましい。

【0174】 基

【0175】

【化30】



【0176】 における、 $X^9$ および $X^{12}$ はそれぞれ独立して窒素原子または基-C( $R^{104}$ )-

(基中、 $R^{104}$ は、水素原子またはハロゲン原子を意味する。)を意味し、 $R^{104}$ におけるハロゲン原子は先に説明したものと同様のものを意味する。

【0177】  $X^{10}$ および $X^{11}$ はそれぞれ独立して窒素原子または基-C( $R^{105}$ )-

(基中、 $R^{105}$ は、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、ハロゲノアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基、シアノ基、アミノ基、アミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基またはアルコキシカルボニルアミ

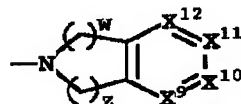
ジノ基を意味する。)を意味する。

【0178】  $R^{105}$ における、ハロゲン原子、ハロゲノアルキル基、アルキル基、アルコキシル基、アルケニル基、保護基としてアルキルシリル基が置換することもあるアルキニル基、アミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、アルコキシカルボニルアミジノ基は先に説明したものと同様のものを意味する。

【0179】 基

【0180】

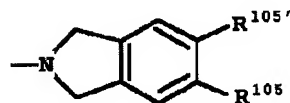
10 【化31】



【0181】 としては、

【0182】

【化32】



【0183】 [基中、 $R^{105}$ は前記に同じ。 $R^{105'}$ は $R^{105}$ と同様のものを意味する。]を意味する基が好ましい。

【0184】 ここで、 $R^{105}$ および $R^{105'}$ のどちらか一方が、ハロゲン原子、アルキニル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基、アルコキシカルボニルアミジノ基であるものが好ましく、中でもハロゲン原子、エチニル基、アミジノ基、ヒドロキシアミジノ基、メトキシカルボニルアミジノ基が特に好ましい。

【0185】 <基 $Q^1$ について>  $Q^1$ は、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基を意味する。

【0186】 置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基は、基 $Q^A$ の項で説明したものと同じものを意味し、より具体的には、①置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の環状炭化水素基が縮合したもの、②置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の環状炭化水素基と置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の複素環式基とが縮合したもの、③置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の複素環式基が縮合したものを意味する。例えば、①のものとしては、インデニル基、インダニル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、アントリル基、フェナントリル基等を挙げることができる。②のものとしては、ベンゾフラニル基、インドリル基、インドリニル基、キノリル基、ベンゾジアジニル基、テトラヒドロイソキノ

リル基、ベンゾチアゾリル基、テトラヒドロベンゾチアゾリル基、イソインドリル基等を挙げることができる。  
③のものとしては、ナフチリジニル基、テトラヒドロチエノピリジニル基、テトラヒドロチアゾロピリジニル基、テトラヒドロピリダジニル基、チアゾロピリダジニル基、テトラヒドロチアゾロピリダジニル基、ピロロピリジニル基、テトラヒドロピロロピリジニル基、ジヒドロピリドキナゾリル基、ピリドピリミジニル基、テトラヒドロピリドピリミジニル基、ピラノチアゾリル基、ジヒドロピラノチアゾリル基、フロピリジニル基、テトラヒドロフロピリジニル基、オキサゾロピリジニル基、テトラヒドロオキサゾロピリジニル基、オキサゾロピリダジニル基、テトラヒドロオキサゾロピリダジニル基等を挙げることができる。

【0187】飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基、飽和もしくは不飽和の3環性の縮合環基に置換し得る置換基としては、以下の群(4)のものを挙げることができる。なお、置換し得る置換基の数は1~7個である。

【0188】群(4): 水酸基、アルキル基、アルケニル基、ハロゲンアルキル基、ハロゲンアルケニル基、アルコキシル基、ヒドロキシャルキル基、アルコキシャルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、アルコキシカルボニル基、ホルミル基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基、アルキルイミノ基、アミジノ基、グアニジノ基、アミノ(ヒドロキシイミノ)アルキル基、アミノ(アルコキシイミノ)アルキル基、アミノ(アリールオキシイミノ)アルキル基、ヒドロキシイミノ基、アルコキシイミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノイミノ基、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニルオキシ基、酸素原子、トリフルオロメチルスルフォニルオキシ基、トリフルオロメチルスルフォニルオキシアルケニル基、ホウ酸基(—B(OH<sub>2</sub>))、ハロゲン原子、水酸基、アミノ基、アルコキシル基、アルキル基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、アルコキシカルボニル基およびアミノカルボニル基からなる群より選ばれる置換基を1個~3個有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の環状炭化水素基、およびハロゲン原子、水酸基、アミノ基、アルコキ

シル基、アルキル基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、アルコキシカルボニル基およびアミノカルボニル基からなる群より選ばれる置換基を1個~3個有することもある飽和もしくは不飽和の5~6員の複素環式基。

【0189】この群(4)の置換基については、基Q<sup>A</sup>の項の群(1)~群(3)で説明したのものと同様のものを意味する。

【0190】本発明においては、Q<sup>1</sup>としては、置換基を有することもあるチエノピリジニル基、置換基を有することもあるテトラヒドロチエノピリジニル基、置換基を有することもあるチアゾロピリジニル基、置換基を有することもあるテトラヒドロチアゾロピリジニル基、置換基を有することもあるチアゾロピリダジニル基、置換基を有することもあるテトラヒドロチアゾロピリダジニル基、置換基を有することもあるピラノチアゾリル基、置換基を有することもあるジヒドロピラノチアゾリル基、置換基を有することもあるフロピリジニル基、置換基を有することもあるテトラヒドロフロピリジニル基、置換基を有することもあるオキサゾロピリジニル基、置換基を有することもあるテトラヒドロオキサゾロピリジニル基、置換基を有することもあるオキサゾロピリダジニル基、置換基を有することもあるテトラヒドロオキサゾロピリダジニル基が好ましい。

【0191】<基Q<sup>2</sup>について>基Q<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、硫黄原子、直鎖状もしくは分枝状の炭素数1~6のアルキレン基、直鎖状もしくは分枝状の炭素数2~6のアルケニレン基、直鎖状もしくは分枝状の炭素数2~6のアルキニレン基、

基—N(R<sup>1</sup>)—CO—

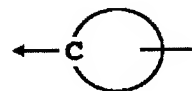
(基中、R<sup>1</sup>は水素原子またはアルキル基を意味する。)、

基—N(R<sup>2</sup>)—(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>—

(基中、R<sup>2</sup>は水素原子またはアルキル基を意味し、mは0~6の整数を意味する。)、または基

【0192】

【化33】



【0193】(この基は、置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の5~6員の環状炭化水素基、置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の5~6員の複素環式基、または置換基を有することもある2価の飽和もしくは不飽和の2環性の縮合環基を意味する。←Cはこの基の炭素原子がQ<sup>1</sup>と結合することを示す。)を意味する。

【0194】基Q<sup>2</sup>において、直鎖状もしくは分枝状の炭素数1~6のアルキレン基としては、例えば、メチレン基、エチレン基、トリメチレン基、プロピレン基、テ

トラメチレン基、ブチレン基、ペンタメチレン基、ヘキサメチレン基等を挙げることができる。

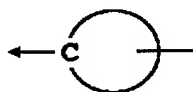
【0195】直鎖状もしくは分枝状の炭素数2～6のアルケニレン基としては、例えば、ビニレン基、プロペニレン基、ブテニレン基およびペンテニレン基等を挙げることができる。なお、二重結合の位置は特に限定されるものではない。

【0196】直鎖状もしくは分枝状の炭素数2～6のアルキニレン基としては、プロピニレン基、ブチニレン基、ペンチニレン基、ヘキシニレン基等を挙げることができる。

【0197】基

【0198】

【化34】



【0199】この基は、置換基を有することもある異原子を1個または2個以上含んでもよい2価の飽和または不飽和の5～6員の環状基を意味し、 $\leftarrow C$ はこの基の炭素原子と $Q^1$ との結合を示すものであり、例えば、シクロヘキシレン基、シクロヘキセニレン基、フェニレン基、ピロールジイル基、チエンジイル基等を挙げることができる。

【0200】基 $-N(R^1)-CO-$ および基 $-N(R^2)-(CH_2)_m-$ における $R^1$ および $R^2$ のアルキル基としては、直鎖状、分枝状、もしくは環状の炭素数1～6のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、イソプロピル基、シクロプロピル基等を挙げることができる。基 $-N(R^1)-CO-$ としては、基 $\leftarrow N(R^1)-CO-$  ( $\leftarrow$ はこの基の窒素原子と $Q^1$ との結合を示す。)が好ましく、また基 $-N(R^2)-(CH_2)_m-$ としては、基 $\leftarrow N(R^2)-(CH_2)_m-$  ( $\leftarrow$ はこの基の窒素原子と $Q^1$ との結合を示す。)が好ましい。

【0201】本発明においては、 $Q^2$ としては、単結合、カルボニル基、フェニレン基、シクロヘキシレン基およびシクロヘキセニレン基が好ましい。

【0202】<基 $Q^3$ について> $Q^3$ における置換基としての $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^{10}$ 、および $R^{11}$ における、アルキル基、アルコキシ基、アルコシアルキル基、ヒドロキシアルキル基、ヒドロキシアルキルオキシ基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルスルホニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシアルキル基、カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキ

ルスルホニルアルキル基、アルコシカルボニル基、アルコシカルボニルアルキル基、アルコシカルボニルアルキルカルボニル基、アルコシカルボニルアルキルスルホニル基、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基およびアミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキルオキシ基は、先に基 $Q^A$ の項の $R^{15}$ において説明したものと同様のものを意味する。

【0203】アルコシアルキルオキシ基は、先に説明したアルコシアルキル基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、メトキシメチルオキシ基、メトキシエチルオキシ基、エトキシメチルオキシ基等を挙げることができる。

【0204】カルボキシアルキルオキシ基とは、上述のカルボキシアルキル基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、カルボキシメチル基、カルボキシエトキシル基等を挙げることができる。

【0205】アルコシカルボニルアルキルオキシ基とは、先に説明したアルコシカルボニルアルキル基と酸素原子とで構成する基を意味し、例えば、メトキシカルボニルエチルオキシ基、エトキシカルボニルエチルオキシ基等を挙げることができる。

【0206】アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルキルスルホニルアミノカルボニルアルキル基とは、上述のアルキルスルホニル基と置換基を1個有することもあるイミノ基とカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6個のアルキレン基とで構成される基を意味し、例えば、メチルスルホニルアミノカルボニルメチル基等を挙げることができる。

【0207】アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアリールスルホニルアミノカルボニルアルキル基とは、アリール基とスルホニル基と置換基を1個有することもあるイミノ基とカルボニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6個のアルキレン基とで構成される基を意味し、例えば、フェニルスルホニルアミノカルボニルメチル基等を挙げることができる。

【0208】アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノスルホニルアルキル基とは、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基とスルホニル基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6個のアルキレン基とで構成される基を意味し、例え

ば、アミノスルホニルメチル基等を挙げることができる。

【0209】シアノアルキル基とは、シアノ基と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6個のアルキレン基とで構成される基を意味する。

【0210】アミノ基部分に置換基を1個有することもあるアルコキシアルキルアミノカルボニルアルキル基とは、上述のアルコキシアルキル基と置換基を1個有することもあるイミノ基とカルボニル基とで構成される基を意味し、例えば、エトキシメチルアミノカルボニルメチル基等を挙げることができる。

【0211】アルキルカルボニルオキシアルキル基とは、上述のアルキルカルボニル基と酸素原子と直鎖状、分枝状もしくは環状の炭素数1～6個のアルキレン基とで構成される基を意味し、例えば、メチルカルボニルオキシエチル基等を挙げることができる。

【0212】基A<sup>1</sup>—B<sup>1</sup>—において、A<sup>1</sup>は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味するが、ここで、飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基としては、例えば、シクロペンチル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、シクロヘキサジエニル基およびフェニル基等を挙げることができる。なお、シクロペンテニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0213】飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基は、少なくとも1個の異原子を含む環式基であり、異原子としては酸素原子、窒素原子および硫黄原子等を挙げることができる。飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基としては、例えば、フリル基、ピロリル基、チエニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、オキサゾリニル基、チアゾリル基、チアゾリニル基、オキサトリアゾリル基、チアジアゾリル基、フラザニル基、ピラニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、オキサジニル基、オキサジアジニル基、モルホリニル基、チアジニル基、チアジアジニル基、チオモルホリニル基、テトラゾリル基、トリアゾリル基およびトリアジニル基等を挙げることができる。なお、ピラニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0214】B<sup>1</sup>は単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、基—O—C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキレン基、基—C(=O)—C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキレン基、基—NH—C(=O)—または基—NH—C(=O)—C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキレン基を意味する。

【0215】基A<sup>1</sup>—B<sup>1</sup>—としては、例えば、以下のようないくつかの基等を挙げることができる。置換基を有すること

ある飽和または不飽和の5～6員の環状炭化水素基、置換基を有することもある飽和または不飽和の5～6員の複素環式基とカルボニル基とで構成する基、および置換基を有することもある飽和または不飽和の5～6員の環状炭化水素基とアルキレン基とで構成する基。

【0216】また、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>、R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>は環を構成する炭素原子とともに一緒になって置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～7員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～7員の複素環式基を意味するが、ここで、飽和もしくは不飽和の5～7員の環状炭化水素基としては、例えば、シクロペンチル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、シクロヘキサジエニル基およびフェニル基等を挙げることができる。なお、シクロペンテニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0217】飽和もしくは不飽和の5～7員の複素環式基は、少なくとも1個の異原子を含む環式基であり、異原子としては酸素原子、窒素原子および硫黄原子等を挙げることができる。飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基としては、例えば、例えば、フリル基、ピロリル基、チエニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリニル基、オキサゾリル基、オキサゾリニル基、チアゾリル基、チアゾリニル基、オキサトリアゾリル基、チアジアゾリル基、フラザニル基、ピラニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、オキサジニル基、オキサジアジニル基、モルホリニル基、チアジニル基、チアジアジニル基、チオモルホリニル基、テトラゾリル基、トリアゾリル基およびトリアジニル基等を挙げることができる。なお、ピラニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0218】Q<sup>3</sup>における置換基としてのR<sup>9</sup>およびR<sup>12</sup>における、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシル基、ヒドロキシアルキルカルボニル基、ヒドロキシアルキルスルホニル基、アルコキシアルキル基、アルコキシアルキルカルボニル基、アルコキシアルキルスルホニル基、ホルミルアルキル基、ホルミルアルキルカルボニル基、ホルミルアルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基、アルキルスルホニル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルキルスルホニルアルキル基、カルボキシアルキルカルボニル基、カルボキシアルキルスルホニル基、カルボキシアルキルカルボニルアルキル基、カルボキシアルキルスルホニルアルキル基、アルコキシカルボニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキルスルホニル基、置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキル基、

アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルオキシ基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノアルキルオキシカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニル基、アミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルアルキル基およびアミノ基部分に置換基を1個もしくは2個有することもあるアミノカルボニルオキシアルキル基は、先に基 $Q^A$ の項において説明したものと同様のものを意味する。

【0219】基 $A^2-B^2$ において、 $A^2$ は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基または置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基を意味するが、ここで、飽和もしくは不飽和の5～6員の環状炭化水素基としては、例えば、シクロペンチル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、シクロヘキサジエニル基およびフェニル基等を挙げることができる。なお、シクロペンテニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0220】飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基は、少なくとも1個の異原子を含む環式基であり、異原子としては酸素原子、窒素原子および硫黄原子等を挙げることができる。飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基としては、例えば、フリル基、ピロリル基、チエニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、オキサゾリニル基、チアゾリル基、チアゾリニル基、オキサトリアゾリル基、チアジアゾリル基、フラザニル基、ピラニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、オキサジニル基、オキサジアジニル基、モルホリニル基、チアジニル基、チアジアジニル基、チオモルホリニル基、テトラゾリル基、トリアゾリル基およびトリアジニル基等を挙げることができる。なお、ピラ

ニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0221】 $B^2$ は単結合、カルボニル基、アルキレン基、カルボニルアルキル基、基 $-O-C_1\sim C_6$ アルキレン基、基 $-COO-C_1\sim C_6$ アルキレン基、基 $-NHCO-$ または基 $-NHCO-C_1\sim C_6$ アルキレン基を意味する。

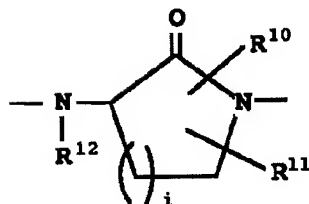
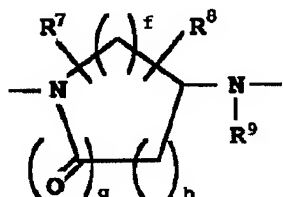
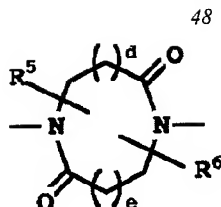
【0222】基 $A^2-B^2$ としては、例えば、以下ののような基等を挙げることができる。置換基を有することもある飽和または不飽和の5～6員の複素環式基、置換基を有することもある飽和または不飽和の5～6員の環状炭化水素基とカルボニル基とで構成する基、および置換基を有することもある飽和または不飽和の5～6員の複素環式基とアルキレン基とで構成する基等。

【0223】また、 $R^9$ および $R^7$ 、 $R^9$ および $R^8$ 、 $R^{12}$ および $R^{10}$ 、 $R^{12}$ および $R^{11}$ は、環を構成する炭素原子と $R^9$ または $R^{12}$ が結合する窒素原子とともに、置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の5～7員の複素環式基を意味するが、ここで、飽和もしくは不飽和の5～7員の複素環式基は、少なくとも1個の窒素原子を含む環式基であり、さらに異原子を含んでもよい。異原子としては酸素原子、窒素原子および硫黄原子等を挙げることができる。飽和もしくは不飽和の5～6員の複素環式基としては、例えば、フリル基、ピロリル基、チエニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、オキサゾリニル基、チアゾリル基、チアゾリニル基、オキサトリアゾリル基、チアジアゾリル基、フラザニル基、ピラニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、オキサジニル基、オキサジアジニル基、モルホリニル基、チアジニル基、チアジアジニル基、チオモルホリニル基、トリアゾリル基およびトリアジニル基等を挙げることができる。なお、ピラニル基のように複数の構造異性がある場合は、それらはすべて含まれる。

【0224】本発明において、 $Q^3$ は以下の基

【0225】

【化35】


$$\begin{array}{c} R^3 \quad R^4 \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{---N} \quad \text{N---} \\ | \quad | \\ (O=C) \quad (C=O) \\ | \quad | \\ (O) \quad (O) \end{array}$$

-25-

されないが、具体的には、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、燐酸塩、硝酸塩および硫酸塩等の鉱酸塩類、安息香酸塩、メタンスルホン酸塩、2-ヒドロキシエタンスルホン酸塩およびp-トルエンスルホン酸塩等の有機スルホン酸塩類、並びに酢酸塩、プロパン酸塩、シュウ酸塩、マロン酸塩、コハク酸塩、グルタル酸塩、アジピン酸塩、酒石酸塩、マレイン酸塩、リンゴ酸塩およびマンデル酸塩等の有機カルボン酸塩類等を挙げることができる。また、溶媒和物としては、医薬的に許容し得る塩であれば特に限定されないが、具体的には、水和物、エタノール和物等を挙げることができる。

【0233】以下に、本発明の一般式(1)で表わされる化合物における好ましい化合物の例を挙げる。

【0234】1-[[ (6RS)-6-アミノメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル]カルボニル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[[ (6RS)-6-アミノメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル]メチル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[[ (2RS)-6-アミノメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル]メチル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[[ (2RS)-6-アミノメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル]カルボニル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[(7-アミノメチルナフタレン-2-イル)カルボニル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

【0235】1-[(7-アミノメチルナフタレン-2-イル)メチル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[(6-アミノメチルナフタレン-2-イル)カルボニル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(イソキノリン-7-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(キノリル-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(4-ヒドロキシキノリン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0236】1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(8-ヒドロキシキノリン-7-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(ベンズイミダゾール5-イル)カルボニル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[(ベンズイミダゾール5-イル)カルボニル]-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ホモピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(チアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(E)-4-クロロスチリルスルホニル]-4-[(チアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0237】1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)メチル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(trans-3-(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)プロペノイル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(3-(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)プロピオニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(3-(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)プロピル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(N-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)メチル]カルバモイル]ピペラジン

【0238】1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-2-エトキシカルボニル-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-カルボキシ-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-アミノヒドロキシイミノメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(N-(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエ

ノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル) カルバモイル] ピペラジン

【0239】 1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [N-メチル-N-(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル) カルバモイル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [[5-(1-ピロリン-2-イル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル] カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-アミノヒドロキシイミノメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-カルバモイル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] ピペラジン

【0240】 1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [[5-(1-ピロリン-2-イル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル] カルボニル] ピペラジン  
1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-ホルミル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [[4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] -5, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム ヨウ化物

【0241】 2- [[4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] -5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン N-オキシド

2-カルバモイル-4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2-カルバモイル-4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [[5-(2-ヒドロキシエチル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル] カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [[5-(ピリジン-2-イル) メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル] カルボニル] ピペラジン

【0242】 1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [[5-(ピリジン-3-イル) メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル] カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [[5-(ピリジン-4-イル) メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル] カルボニル] ピペラジン

1- [(E) -4-クロロスチリルスルホニル] -4- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(E) -4-クロロスチリルスルホニル] -4- [5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

(3S) -3- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホンアミド] -1- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル) メチル] ピロリジン

【0243】 (3S) -3- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホンアミド] -1- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピロリジン

(3S) -1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -3- [[4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル) メチル] アミノ] ピロリジン

(3S) -3- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル) カルボニルアミノ] -1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] ピロリジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ホモピペラジン

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホンアミド] -1- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0244】 1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(6-アミノヒドロキシイミ



ノメチルベンゾフラン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-アミノヒドロキシミノメチルベンゾチエン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(2-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-6-イル)カルボニル]ピペラジン

6-[[4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン-1-イル)カルボニル]-2, 2-ジメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニウム ヨウ化物

【0245】1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[(6-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ[2, 3-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-クロロベンゾ[b]フラン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]フラン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0246】1-[(5-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1, 6-ナフチリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(6-メチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1, 6-ナフチリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0247】1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-エチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(1-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(1, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(6-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロフロ[2, 3-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0248】1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(3-ヒドロキシ-6-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロフロ[2, 3-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-3-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2, 6-ビス(カルバモイルメチル)-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0249】cis-2, 6-ビス(カルバモイルメチル)-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-

イル) カルボニル] ピペラジン4- [(5-クロロイソインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] -5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム ヨウ化物

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [(N-メチル) カルバモイル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

【0250】 N- [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-イル] カルボニル] グリシン エチルエステル

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [N- (モルホリン-4-イル) カルバモイル] ピペラジンN' - [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-イル] カルボニル] ヒドラジノ酢酸エチルエステル

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [N- [(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] カルバモイル] ピペラジン

4- [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-イル] カルボニル] モルホリン

【0251】 4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- (エトキシカルボニル) -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

[4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル

ボニル] ピペラジン-2-イル] 酢酸 メチルエステル

2- [[N- (tert-ブトキシ) アミノ] カルボニル] -4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

[4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-イル] アセトアミド

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [(N-イソプロピル) カルバモイル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0252】 4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [(ピペリジン-1-イル) カルボニル] メチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [[N- (2-メトキシベンジル)] カルバモイル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [[N- (2-メトキシエチル)] カルバモイル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-カルボン酸

N' - [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-イル] カルボニル] ヒドラジノ酢酸

【0253】 4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [[N- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)] カルバモイル] ピペラジン

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-ヒドロオキサム酸

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [[N- (2-ヒドロキシベンジル)] カル

ル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル  
ボニル] ピペラジン

【0256】1-〔〔5-〔(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル〕 インドール-2-イル〕 スルホニル〕 -4-〔(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ〔5, 4-c〕ピリジン-2-イル) カルボニル〕 ピペラジン

1- [ [6- [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル] スルホニル] -4- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-4-[[5-(N-メトキシカルボニルアミジノ)インドール-2-イル]スルホニル]ピペラジン

1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4-[ [6-[N-(メトキシカルボニル) アミノ] インドール-2-イル] スルホニル] ピペラジン

1-[(5-アミジノベンゾ [b] チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0257】1-[(6-アミジノベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [ [5- [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル] -4- [ (5-メチルー4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [ [6- [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル] -4- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-4-[[5-[N-(メトキシカルボニル)アミノ]ベンゾ[b]チエン-2-イル]スルホニル]ピペラジン

1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-4-[[6-[N-(メトキシカルボニル)アミノ]ベンゾ[b]チエン-2-イル]スルホニル]ピペラジン

【0258】 4-[(5-アミジノイソインドール-2

1-[(6-アミジノインドール-2-イル)スルホニ

4- [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-2- [(モルホリン-4-イルカルボニル)メチ  
 ル]-1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)カル  
 ボニル] ピペラジン4- [(5-エチニルインドール-

2-イル) スルホニル] -2- [(モルホリン-4-イルカルボニル) メチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-エチニルイソインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0263】 4- [(5-クロロイソインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- (カルバモイルメチル) -4- [(5-クロロイソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- (カルバモイルメチル) -4- [(5-エチニルイソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロイソインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイルメチル) -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロイソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (N, N-ジメチルカルバモイルメチル) ピペラジン

【0264】 4- [(5-クロロイソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イルカルボニル) メチル] ピペラジン

4- [(5-プロモイソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (モルホリノカルボニルメチル) ピペラジン

4- [(5-エチニルイソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イルカルボニル) メチル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-2-イル) カ

ルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0265】 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイルメチル) -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (モルホリノカルボニルメチル) -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -2- (モルホリノカルボニルメチル) -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-プロモインドール-2-イル) スルホニル] -2- (モルホリノカルボニルメチル) -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2, 6-ビス (カルバモイルメチル) -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0266】 4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2, 6-ビス (カルバモイルメチル) -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(エトキシカルボニルメチル) アミノカルボニル] メチル] -1- [(4, 5-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(エトキシカルボニルメチル) アミノカルボニル] メチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン

-2-イル)カルボニル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-2-[[[カルボキシメチル)アミノカルボニ  
 ル]メチル]-1-[(4,5-ジメチル-4,5,  
 6,7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン  
 -2-イル)カルボニル]ピペラジン  
 【0267】4-[(5-クロロインドール-2-イ  
 ル)スルホニル]-2-[[[カルボキシメチル)アミ  
 ノカルボニル]メチル]-1-[(5-メチル-4,  
 5,6,7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリ 10  
 ジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(4,5-ジメチル-4,5,6,7-テ  
 トラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イ  
 ル)カルボニル]-2-[[[テトラゾール-5-イ  
 ル)メチル]アミノカルボニル]メチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(5-メチル-4,5,6,7-テトラ  
 ヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イル)カ  
 ルボニル]-2-[[[テトラゾール-5-イル)メ 20  
 チル]アミノカルボニル]メチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(4,5-ジメチル-4,5,6,7-テ  
 トラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イ  
 ル)カルボニル]-2-[(テトラゾール-5-イル)  
 メチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(5-メチル-4,5,6,7-テトラ  
 ヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イル)カ  
 ルボニル]-2-[(テトラゾール-5-イル)メチ 30  
 ル]ピペラジン  
 【0268】4-[(5-クロロインドール-2-イ  
 ル)スルホニル]-1-[(4,5-ジメチル-4,  
 5,6,7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリ  
 ジン-2-イル)カルボニル]-2-[2-(テトラゾ  
 ール-5-イル)エチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(5-メチル-4,5,6,7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イル)カル  
 ボニル]-2-[2-(テトラゾール-5-イル)エチ 40  
 ル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(4,5-ジメチル-4,5,6,7-テ  
 トラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イ  
 ル)カルボニル]-2-[2-(2-オキソピロリジン-1  
 -イル)メチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(5-メチル-4,5,6,7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イル)カル  
 ボニル]-2-[2-(2-オキソピロリジン-1-イル) 50  
 メチル]ピペラジン

メチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(4,5-ジメチル-4,5,6,7-テ  
 トラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イ  
 ル)カルボニル]-2-[2-(2-オキソピロリジン  
 -1-イル)エチル]ピペラジン  
 【0269】4-[(5-クロロインドール-2-イ  
 ル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4,5,6,  
 7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2  
 -イル)カルボニル]-2-[2-(2-オキソピロリ  
 ジン-1-イル)エチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-2-[(4-ヒドロキシ-2-オキソピロリジン  
 -1-イル)メチル]-1-[(4,5-ジメチル-  
 4,5,6,7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-c]  
 ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-2-[(4-ヒドロキシ-2-オキソピロリジン  
 -1-イル)メチル]-1-[(5-メチル-4,5,  
 6,7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン  
 -2-イル)カルボニル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-2-[2-(4-ヒドロキシ-2-オキソピロリ  
 ジン-1-イル)エチル]-1-[(4,5-ジメチル  
 -4,5,6,7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-  
 c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-2-[2-(4-ヒドロキシ-2-オキソピロリ  
 ジン-1-イル)エチル]-1-[(5-メチル-4,  
 5,6,7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリ  
 ジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン  
 【0270】4-[(5-クロロインドール-2-イ  
 ル)スルホニル]-1-[(4,5-ジメチル-4,  
 5,6,7-テトラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリ  
 ジン-2-イル)カルボニル]-2-[2-(2,5-ジオ  
 キソピロリジン-1-イル)メチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(5-メチル-4,5,6,7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イル)カル  
 ボニル]-2-[2-(2,5-ジオキソピロリジン-1-  
 イル)メチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(4,5-ジメチル-4,5,6,7-テ  
 トラヒドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イ  
 ル)カルボニル]-2-[2-(2,5-ジオキソピロ  
 リジン-1-イル)エチル]ピペラジン  
 4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
 ル]-1-[(5-メチル-4,5,6,7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イル)カル  
 ボニル]-2-[2-(2,5-ジオキソピロリジン- 50  
 1-イル)メチル]ピペラジン







5

ニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラ  
 ヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
 ルボニル] -2- [(テトラゾール-5-イル) メチ  
 ル] ピペラジン  
 1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
 アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
 ル] -4- [[5- [N- (メトキシカルボニル) アミ  
 ジノ] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル] -  
 2- [(テトラゾール-5-イル) メチル] ピペラジン  
 4- [(5-アミジノインドール-2-イル) スル  
 ホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テト  
 ラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)  
 カルボニル] -2- [(テトラゾール-5-イル) メチ  
 ル] ピペラジン  
 4- [[5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
 ル] イソインドール-2-イル] スルホニル] -1-  
 [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ  
 ロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -  
 2- [(テトラゾール-5-イル) メチル] ピペラジン  
 4- [[5- [N- (メトキシカルボニル) アミジノ]  
 イソインドール-2-イル] スルホニル] -1- [(5-  
 メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ  
 [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2-  
 [(テトラゾール-5-イル) メチル] ピペラジン  
 【0284】 2- [[4- [(6-クロロナフタレン-  
 2-イル) スルホニル] -2- [(テトラゾール-5-  
 イル) メチル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] -  
 5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化  
 物  
 2- [[4- [(5-クロロインドール-2-イル) ス  
 ルホニル] -2- [(テトラゾール-5-イル) メチ  
 ル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] -5-メチル  
 チアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物  
 4- [(7-アミジノナフタレン-2-イル) スルホ  
 ニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
 ルボニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチ  
 ル] ピペラジン  
 4- [(6-アミジノナフタレン-2-イル) スルホ  
 ニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
 ルボニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチ  
 ル] ピペラジン  
 1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
 アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
 ル] -4- [[6- [N- (メトキシカルボニル) アミ  
 ジノ] ナフタレン-2-イル] スルホニル] -2- [2-  
 (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジン  
 【0285】 4- [(6- [(アミノ) (ヒドロキシイ  
 ミノ) メチル] ナフタレン-2-イル) スルホニル] -

1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
 アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
 ル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチル]  
 ピペラジン  
 4- [(5-エチルインドール-2-イル) スルホ  
 ニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
 ルボニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチ  
 ル] ピペラジン  
 4- [(5-アミジノインドール-2-イル) スルホ  
 ニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
 ルボニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチ  
 ル] ピペラジン  
 4- [(6-アミジノインドール-2-イル) スルホ  
 ニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
 ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
 ルボニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチ  
 ル] ピペラジン  
 4- [[5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
 ル] インドール-2-イル] スルホニル] -1- [(5-  
 メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ  
 [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2-  
 [2- (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジ  
 ン  
 【0286】 4- [[6- [(アミノ) (ヒドロキシイ  
 ミノ) メチル] インドール-2-イル] スルホニル] -  
 1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
 アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
 ル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチル]  
 ピペラジン  
 1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
 アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
 ル] -4- [[5- (N-メトキシカルボニルアミジ  
 ノ) インドール-2-イル] スルホニル] -2- [2-  
 (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジン  
 1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
 アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
 ル] -4- [[6- [N- (メトキシカルボニル) アミ  
 ジノ] インドール-2-イル] スルホニル] -2- [2-  
 (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(5-アミジノベンゾ [b] チエン-2-イル)  
 スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-  
 テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イ  
 ル) カルボニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イ  
 ル) エチル] ピペラジン  
 4- [[5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
 ル] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル] -  
 1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
 アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ

ル] - 2 - [2 - (テトラゾール-5-イル) エチル]  
ピペラジン

【0287】 1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イ  
ル) カルボニル] - 4 - [(5- [N- (メトキシカル  
ボニル) アミジノ] ベンゾ [b] チエン-2-イル]  
スルホニル] - 2 - [2 - (テトラゾール-5-イル)  
エチル] ピペラジン

4 - [(5-アミジノインドール-2-イル) スル  
ホニル] - 1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)  
カルボニル] - 2 - [2 - (テトラゾール-5-イル)  
エチル] ピペラジン

4 - [(5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] イソインドール-2-イル) スルホニル] - 1 -  
[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ  
ロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -  
2 - [2 - (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラ  
ジン

4 - [(5- [N- (メトキシカルボニル) アミジノ]  
イソインドール-2-イル) スルホニル] - 1 - [(5-  
メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ  
[5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] - 2 -  
[2 - (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジ  
ン

2 - [(4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) ス  
ルホニル] - 2 - [2 - (テトラゾール-5-イル) エ  
チル] ピペラジン1-イル) カルボニル] - 5-メチル  
チアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

【0288】 2 - [(4- [(5-クロロインドール-  
2-イル) スルホニル] - 2 - [2 - (テトラゾール-  
5-イル) エチル] ピペラジン1-イル) カルボニル]  
- 5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃  
化物

4 - [(7-アミジノナフタレン-2-イル) スルホ  
ニル] - 1 - [(6-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル  
ボニル] - 2 - [N- [(テトラゾール-5-イル) メ  
チル] カルバモイル] ピペラジン

4 - [(6-アミジノナフタレン-2-イル) スルホ  
ニル] - 1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル  
ボニル] - 2 - [N- [(テトラゾール-5-イル) メ  
チル] カルバモイル] ピペラジン

1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
ル] - 4 - [(6- [N- (メトキシカルボニル) アミ  
ジノ] ナフタレン-2-イル) スルホニル] - 2 - [N-  
[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイ  
ル] ピペラジン

4 - [(6- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] ナフタレン-2-イル) スルホニル] - 1 - [(5-  
メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ  
[5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] - 2 -  
[N- [(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバ  
モイル] ピペラジン

【0289】 4 - [(5-エチルインドール-2-イ  
ル) スルホニル] - 1 - [(5-メチル-4, 5, 6,  
7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-  
イル) カルボニル] - 2 - [N- [(テトラゾール-  
5-イル) メチル] カルバモイル] ピペラジン

4 - [(5-アミジノインドール-2-イル) スルホ  
ニル] - 1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル  
ボニル] - 2 - [N- [(テトラゾール-5-イル) メ  
チル] カルバモイル] ピペラジン

4 - [(6-アミジノインドール-2-イル) スルホ  
ニル] - 1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル  
ボニル] - 2 - [N- [(テトラゾール-5-イル) メ  
チル] カルバモイル] ピペラジン

4 - [(5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] インドール-2-イル) スルホニル] - 1 - [(5-  
メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ  
[5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] - 2 -  
[N- [(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバ  
モイル] ピペラジン

4 - [(6- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] インドール-2-イル) スルホニル] - 1 - [(5-  
メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ  
[5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] - 2 -  
[N- [(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバ  
モイル] ピペラジン

【0290】 1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イ  
ル) カルボニル] - 4 - [(5- (N-メトキシカルボ  
ニルアミジノ) インドール-2-イル) スルホニル] -  
2 - [N- [(テトラゾール-5-イル) メチル] カル  
バモイル] ピペラジン

1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ  
アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
ル] - 4 - [(6- [N- (メトキシカルボニル) アミ  
ジノ] インドール-2-イル) スルホニル] - 2 - [N-  
[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイ  
ル] ピペラジン

4 - [(5-アミジノベンゾ [b] チエン-2-イル)  
スルホニル] - 1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-  
テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イ  
ル) カルボニル] - 2 - [N- [(テトラゾール-5-  
イル) メチル] カルバモイル] ピペラジン



4-[(5-アミジノベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-2-[N-[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイルメチル] ピペラジン

4-[(5-[(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-2-[N-[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイルメチル] ピペラジン

1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-4-[(5-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] ベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル]-2-[N-[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイルメチル] ピペラジン

4-[(5-アミジノイソインドール-2-イル) スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-2-[N-[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイルメチル] ピペラジン

【0295】4-[(5-[(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] イソインドール-2-イル) スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-2-[N-[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイルメチル] ピペラジン

4-[(5-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] イソインドール-2-イル) スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-2-[N-[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイルメチル] ピペラジン

2-[(4-[(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル]-2-[N-[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイルメチル] ピペラジン1-イル) カルボニル]-5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

2-[(4-[(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル]-2-[N-[(テトラゾール-5-イル) メチル] カルバモイルメチル] ピペラジン1-イル) カルボニル]-5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

4-[(7-アミジノナフタレン-2-イル) スルホニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0296】4-[(6-アミジノナフタレン-2-イル)

ル) スルホニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-4-[6-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] ナフタレン-2-イル] スルホニル] ピペラジン

4-[(6-[(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ナフタレン-2-イル) スルホニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4-[(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4-[(5-アミジノインドール-2-イル) スルホニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0297】4-[(6-アミジノインドール-2-イル) スルホニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4-[(5-[(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル) スルホニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4-[(6-[(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル) スルホニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-4-[5-(N-メトキシカルボニルアミジノ) インドール-2-イル] スルホニル] ピペラジン

1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]-2-(エトキシカルボニルメチル)-4-[6-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] インドール-2-イル] スルホニル] ピペラジン

【0298】4-[(5-アミジノベンゾ [b] チエン

ー2-イル)スルホニル]ー2-(エトキシカルボニルメチル)ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

4-[ [5-[ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル]ー2-(エトキシカルボニルメチル)ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]ー2-(エトキシカルボニルメチル)ー4-[ [5-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル] ピペラジン

4-[ (5-アミジノインドール-2-イル) スルホニル]ー2-(エトキシカルボニルメチル)ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4-[ [5-[ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] イソインドール-2-イル] スルホニル]ー2-(エトキシカルボニルメチル)ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0299】2-(エトキシカルボニルメチル)ー4-[ [5-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] イソインドール-2-イル] スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2-[ [4-[ (6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル]ー2-(エトキシカルボニルメチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル]ー5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

2-[ [4-[ (5-クロロインドール-2-イル) スルホニル]ー2-(エトキシカルボニルメチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル]ー5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

4-[ (7-アミジノナフタレン-2-イル) スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

4-[ (6-アミジノナフタレン-2-イル) スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

【0300】1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]ー4-[ [6-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] ナフタレン-2-イル] スルホニル] ピペラジン-2-酢酸

4-[ (6-[ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ナフタレン-2-イル) スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

4-[ (5-エチルインドール-2-イル) スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

10 4-[ (5-アミジノインドール-2-イル) スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

4-[ (6-アミジノインドール-2-イル) スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

【0301】4-[ [5-[ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル] スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

4-[ [6-[ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル] スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]ー4-[ [5-(N-メトキシカルボニルアミジノ) インドール-2-イル] スルホニル] ピペラジン-2-酢酸

1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]ー4-[ [6-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] インドール-2-イル] スルホニル] ピペラジン-2-酢酸

4-[ (5-アミジノベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

【0302】4-[ [5-[ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル]ー1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-酢酸

1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]ー4-[ [5-[N-(メトキシカルボニル) アミジノ] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル]

ピペラジン-2-酢酸

4-[(5-アミジノインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン-2-酢酸 4-[(5-[(アミノ)(ヒドロキシイミノ)メチル]イソインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン-2-酢酸

4-[(5-[N-(メトキシカルボニル)アミジノ]イソインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン-2-酢酸

【0303】2-[[2-(カルボキシメチル)-4-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン-1-イル)カルボニル]-5-メチルチアゾロ[5, 4-c]ピリジニウム 沃化物

2-[[2-(カルボキシメチル)-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン-1-イル)カルボニル]-5-メチルチアゾロ[5, 4-c]ピリジニウム 沃化物

4-[(7-アミジノナフタレン-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(6-アミジノナフタレン-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-4-[[6-[N-(メトキシカルボニル)アミジノ]ナフタレン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

【0304】4-[(6-[(アミノ)(ヒドロキシイミノ)メチル]ナフタレン-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-アミジノインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

ル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(6-アミジノインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

10 4-[(5-[(アミノ)(ヒドロキシイミノ)メチル]インドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0305】4-[[6-[(アミノ)(ヒドロキシイミノ)メチル]インドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

20 1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-4-[(5-[N-(メトキシカルボニル)アミジノ]インドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン

2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-4-[[6-[N-(メトキシカルボニル)アミジノ]インドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン

30 4-[(5-アミジノベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[[5-[(アミノ)(ヒドロキシイミノ)メチル]ベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

40 【0306】2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-4-[[5-[N-(メトキシカルボニル)アミジノ]ベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

4-[(5-アミジノインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

チアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [ [5- [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] イソインドール-2-イル] スルホニル] -2- [ (N-メチルカルバモイル) メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
2- [ (N-メチルカルバモイル) メチル] -4- [ [5- [N- (メトキシカルボニル) アミジノ] イソインドール-2-イル] スルホニル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
2- [ [2- [ (N-メチルカルバモイル) メチル] -4- [ (6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] -5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

【0307】 2- [ [2- [ (N-メチルカルバモイル) メチル] -4- [ (5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] -5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

4- [ (7-アミジノナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -4- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [ (6-アミジノナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -4- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [ [6- [N- (メトキシカルボニル) アミジノ] ナフタレン-2-イル] スルホニル] ピペラジン

4- [ (6- [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0308】 4- [ (5-エチルインドール-2-イル) スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [ (5-アミジノインドール-2-イル) スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カル

バモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [ (6-アミジノインドール-2-イル) スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [ [5- [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル] スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [ [6- [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル] スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0309】 2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [ [5- (N-メトキシカルボニルアミジノ) インドール-2-イル] スルホニル] ピペラジン

2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [ [6- [N- (メトキシカルボニル) アミジノ] インドール-2-イル] スルホニル] ピペラジン

4- [ (5-アミジノベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [ [5- [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル] -2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [ [N- (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル] メチル] -1- [ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [ [5- [N- (メトキシカルボニル) アミジノ] ベンゾ [b] チエン-2-イル] スルホニル] ピペラジン

【0310】 4- [ (5-アミジノイソインドール-2



—イル) スルホニル] —2— [ [N— (エトキシカルボ  
ニルメチル) カルバモイル] メチル] —1— [ (5—メ  
チル—4, 5, 6, 7—テトラヒドロチアゾロ [5, 4  
—c] ピリジン—2—イル) カルボニル] ピペラジン  
4— [ [5— [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] イソインドール—2—イル] スルホニル] —2—  
[ [N— (エトキシカルボニルメチル) カルバモイル]  
メチル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル)  
カルボニル] ピペラジン

2— [ [N— (エトキシカルボニルメチル) カルバモイ  
ル] メチル] —4— [ [5— [N— (メトキシカルボニ  
ル) アミジノ] イソインドール—2—イル] スルホニ  
ル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カル  
ボニル] ピペラジン

2— [ [4— [ (6—クロロナフタレン—2—イル) ス  
ルホニル] —2— [ [N— (エトキシカルボニルメチ  
ル) カルバモイル] メチル] ピペラジン—1—イル] カ  
ルボニル] —5—メチルチアゾロ [5, 4—c] ピリジ  
ニウム 沃化物

4— [ (7—アミジノナフタレン—2—イル) スルホニ  
ル] —2— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモイ  
ル] メチル] —4— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—  
テトラヒドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル)  
カルボニル] ピペラジン

【0311】 4— [ (6—アミジノナフタレン—2—イル)  
スルホニル] —2— [ [N— (カルボキシメチル)  
カルバモイル] メチル] —4— [ (5—メチル—4,  
5, 6, 7—テトラヒドロチアゾロ [5, 4—c] ピリ  
ジン—2—イル) カルボニル] ピペラジン

2— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチ  
ル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カル  
ボニル] —4— [ [6— [N— (メトキシカルボニル)  
アミジノ] ナフタレン—2—イル] スルホニル] ピペ  
ラジン

4— [ (6— [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] ナフタレン—2—イル) スルホニル] —2— [ [N  
— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチル] —1—  
[ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒドロチアゾ  
ロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カルボニル] ピ  
ペラジン

2— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチ  
ル] —4— [ (5—エチニルインドール—2—イル) ス  
ルホニル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル)  
カルボニル] ピペラジン

4— [ (5—アミジノインドール—2—イル) スルホニ  
ル] —2— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモイ

ル] メチル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—  
テトラヒドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル)  
カルボニル] ピペラジン

【0312】 4— [ (6—アミジノインドール—2—イル)  
スルホニル] —2— [ [N— (カルボキシメチル)  
カルバモイル] メチル] —1— [ (5—メチル—4,  
5, 6, 7—テトラヒドロチアゾロ [5, 4—c] ピリ  
ジン—2—イル) カルボニル] ピペラジン

4— [ [5— [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] インドール—2—イル] スルホニル] —2— [ [N  
— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチル] —1—  
[ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒドロチアゾ  
ロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カルボニル] ピ  
ペラジン

4— [ [6— [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] インドール—2—イル] スルホニル] —2— [ [N  
— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチル] —1—  
[ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒドロチアゾ  
ロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カルボニル] ピ  
ペラジン

2— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチ  
ル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カル  
ボニル] —4— [ [5— (N—メトキシカルボニルアミ  
ジノ) インドール—2—イル] スルホニル] ピペラジン  
2— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチ  
ル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カル  
ボニル] —4— [ [6— [N— (メトキシカルボニル)  
アミジノ] インドール—2—イル] スルホニル] ピペ  
ラジン

【0313】 4— [ (5—アミジノベンゾ [b] チエン  
—2—イル) スルホニル] —2— [ [N— (カルボキシ  
メチル) カルバモイル] メチル] —1— [ (5—メチル  
—4, 5, 6, 7—テトラヒドロチアゾロ [5, 4—  
c] ピリジン—2—イル) カルボニル] ピペラジン  
4— [ [5— [ (アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチ  
ル] ベンゾ [b] チエン—2—イル] スルホニル] —2  
— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチ  
ル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カル  
ボニル] ピペラジン

2— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモイル] メチ  
ル] —1— [ (5—メチル—4, 5, 6, 7—テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4—c] ピリジン—2—イル) カル  
ボニル] —4— [ [5— [N— (メトキシカルボニル)  
アミジノ] ベンゾ [b] チエン—2—イル] スルホニ  
ル] ピペラジン

4— [ (5—アミジノイソインドール—2—イル) スル  
ホニル] —2— [ [N— (カルボキシメチル) カルバモ

イル] メチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] イソインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(N- (カルボキシメチル) カルバモイル) メチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0314】 2- [(N- (カルボキシメチル) カルバモイル) メチル] -4- [(5- [(N- (メトキシカルボニル) アミジノ) イソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [(2- [(N- (カルボキシメチル) カルバモイル) メチル] -4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル) カルボニル] -5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

2- [(2- [(N- (カルボキシメチル) カルバモイル) メチル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル) カルボニル] -5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

4- [(7-アミジノナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(6-アミジノナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0315】 1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6- [(N- (メトキシカルボニル) アミジノ) ナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(6- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル

ボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5-アミジノインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(6-アミジノインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0316】 4- [(5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(6- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] インドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(5- (N-メトキシカルボニルアミジノ) インドール-2-イル) スルホニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6- [(N- (メトキシカルボニル) アミジノ) インドール-2-イル) スルホニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5-アミジノベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0317】 4- [(5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] ベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(5- [(N- (メトキシカルボニル) アミジノ) ベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -

2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5-アミジノイソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5- [(アミノ) (ヒドロキシイミノ) メチル] イソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5- [N- (メトキシカルボニル) アミジノ] イソインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0318】 2- [(4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン-1-イル) カルボニル] -5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

2- [(4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(モルフォリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン-1-イル) カルボニル] -5-メチルチアゾロ [5, 4-c] ピリジニウム 沃化物

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4-シアノ-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2, 5-ジオキソピロリジン-1-イル) エチル] ピペラジン

1- [(4-カルバモイル-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [2- (2, 5-ジオキソピロリジン-1-イル) エチル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4-ジメチルアミノ-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2, 5-ジオキソピロリジン-1-イル) エチル] ピペラジン

【0319】 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4-シアノ-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジン

1- [(4-カルバモイル-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2

-イル) カルボニル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4-ジメチルアミノ-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [2- (テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4-シアノ-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [[[(エトキシカルボニル) メチル] アミノ] カルボニル] メチル] ピペラジン

1- [(4-カルバモイル-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [[[(エトキシカルボニル) メチル] アミノ] カルボニル] メチル] ピペラジン

【0320】 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4-ジメチルアミノ-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [[[(エトキシカルボニル) メチル] アミノ] カルボニル] メチル] ピペラジン

2- [[[(カルボキシメチル) アミノ] カルボニル] メチル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4-シアノ-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(4-カルバモイル-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [[[(カルボキシメチル) アミノ] カルボニル] メチル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

2- [[[(カルボキシメチル) アミノ] カルボニル] メチル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(4-ジメチルアミノ-5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [7- [(ジメチルアミノ) メチル] ベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

【0321】 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [7- [(ジメチルアミノ) メチル] チアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[7-[(ジメチルアミノ)メチル]-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル)カルボニル]-2-(N-メチルカルバモイル)ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[7-[(モルホリン-4-イル)メチル]ベンゾチアゾール-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[6-(モルホリン-4-イル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[7-(ピペリジン-1-イル)ベンゾチアゾール-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0322】4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[6-(ピペリジン-1-イル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルフォニル]-4-[(2-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルフォニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ[3, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルフォニル]-4-[(2-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル)カルボニル]-2-[(モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルフォニル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ[3, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-[(モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]ピペラジン

【0323】4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルフォニル]-1-[(5-メトキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-[(モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]ピペラジン

4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルフォニル]-2-[(モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]-1-[(5-スルフォ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-

イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルフォニル]-2-(2-シアノエチル)-1-[(5-スルフォ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-2-[[[(モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(6-エチルベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-2-[[[(モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0324】4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]-2-[[[(モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]ピペラジン

4-[(6-エチルベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]-2-[[[(モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-エチルベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0325】1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]-4-[(6-エチルベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]ピペラジン

4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(6-エチルベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン





2-イル)カルボニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

【0334】4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン  
4- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-シアノエチル) -1- [(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0335】2- (2-シアノエチル) -4- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] -1- [(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] -4- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(5, 6-ジヒドロベンゾ [f] イソキノリン-8-イル) カルボニル] ピペラジン  
1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(5, 6-ジヒドロピリド [4, 3-f] キナゾリン-3-イル) カルボニル] ピペラジン

【0336】8- [(1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-4-イル) カルボニル] -5, 6-ジヒドロベンゾ [f] イソキノリンN-オキシド

3- [(1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-4-イル) カルボニル] -5, 6-ジヒドロピリド [4, 3-f] キナゾリン N-オキシド

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メタンズルホニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メタンズルホニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メタンズルホニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0337】4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-シアノエチル) -1- [(5-メタンズルホニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [4, 5-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メタンズルホニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メタンズルホニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メタンズルホニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0338】4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-シアノエチル) -1- [(5-メタンズルホニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-5-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-5-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(2-ジメチルアミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-5-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-5-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0339】 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

【0340】 1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ

アゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] ピペラジン

1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] ピペラジン

1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-シアノエチル) ピペラジン

【0341】 1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (2-シアノエチル) -4- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] ピペラジン

1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] ピペラジン

1- [(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] -4- [(6-エチルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルフォニル] -4- [(2-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ [3, 4-c] ピリジン-5-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルフォニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ [3, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0342】 1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルフォニル] -4- [(2-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ [3, 4-c] ピリジン-5-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルフォニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ [3, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

1- [(5-エチルインドール-2-イル) スルフォニル] -4- [(2-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロピロロ [3, 4-c] ピリジン-5-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-エチルインドール-2-イル) スルフォ



ニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラ  
ヒドロピロ [3, 4-c] ピリジン-5-イル) カル  
ボニル] ピペラジン

1- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルフォ  
ニル] -4- [(2-メチル-4, 5, 6, 7-テトラ  
ヒドロピロ [3, 4-c] ピリジン-5-イル) カル  
ボニル] -2- [(モルホリン-4-イルカルボニル)  
メチル] ピペラジン

【0343】 1- [(5-エチニルインドール-2-イル)  
スルフォニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロピロ [3, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
ルボニル] -2- [(モルホリン-4-イルカルボニ  
ル) メチル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルフォ  
ニル] -1- [(5-メトキシ-4, 5, 6, 7-テトラ  
ヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
ルボニル] -2- [(モルホリン-4-イルカルボニ  
ル) メチル] ピペラジン

4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルフォ  
ニル] -1- [(5-メトキシ-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)  
カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イルカルボ  
ニル) メチル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルフォ  
ニル] -2- [(モルホリン-4-イルカルボニル) メ  
チル] -1- [(5-スルフォ-4, 5, 6, 7-テトラ  
ヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
ルボニル] -ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルフォ  
ニル] -2- (2-シアノエチル) -1- [(5-スル  
フォ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-  
c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -ピペラジン

【0344】 4- [(5-エチニルインドール-2-イル)  
スルフォニル] -2- [(モルホリン-4-イルカ  
ルボニル) メチル] -1- [(5-スルフォ-4, 5,  
6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリ  
ジン-2-イル) カルボニル] -ピペラジン

2- (2-シアノエチル) -4- [(5-エチニルイ  
ンドール-2-イル) スルフォニル] -1- [(5-ス  
ルフォ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-  
c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル]  
メチル] -1- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチア  
ゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カルボ  
ニル] ピペラジン

4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニル]  
メチル] -1- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチア  
ゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カルボ

ニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -1- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イ  
ル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル)  
カルボニル] メチル] ピペラジン

【0345】 1- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6,  
7-テトラヒドロチアゾロ [4, 5-d] ピリダジン-  
2-イル) カルボニル] -4- [(5-エチニルイ  
ンドール-2-イル) スルホニル] -2- [(モルホ  
リン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -4- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ  
ロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カルボニル] ピ  
ペラジン

1- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -4- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ  
ロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カルボニル] ピ  
ペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -4- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イ  
ル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カ  
ルボニル] -4- [(5-エチニルインドール-2-イ  
ル) スルホニル] ピペラジン

【0346】 4- [(5-クロロインドール-2-イ  
ル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) -  
1- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [4,  
5-d] ピリダジン-2-イル) カルボニル] ピペラ  
ジン

4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -2- (N-メチルカルバモイル) -1- [(4,  
5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [4, 5-d] ピ  
リダジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -1- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イ  
ル) カルボニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピ  
ペラジン

1- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カ  
ルボニル] -4- [(5-エチニルインドール-2-イ  
ル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピ  
ペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホ  
ニル] -2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メ  
チル] -1- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ  
ロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カルボニル] ピ

【0349】 4-[(5-エチニルインドール-2-イ 50

1-[(5-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチ

ル] - 4 - [ ( 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロオキサゾ  
ロ [ 4 , 5 - d ] ピリダジン - 2 - イル ) カルボニル ]  
ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(5,6-ジメチル-4,5,6,7-テトラヒドロオキサゾロ[4,5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5,6-ジメチル-4,5,6,7-テトラヒドロオキサゾロ[4,5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン

【0354】4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5,6-ジメチル-4,5,6,7-テトラヒドロオキサゾロ[4,5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]-2-(N-メチルカルバモイル)ピペラジン

1-[(5,6-ジメチル-4,5,6,7-テトラヒドロオキサゾロ[4,5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N-メチルカルバモイル)ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N,N-ジメチルカルバモイル)メチル]-1-[(4,5,6,7-テトラヒドロオキサソロ[4,5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0355】2-[(N,N-ジメチルカルバモイル)メチル]-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(4,5,6,7-テトラヒドロオキサゾロ[4,5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N,N-ジメチルカルバモイル)メチル]-1-[(5,6-ジメチル-4,5,6,7-テトラヒドロオキサゾロ[4,5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] - 1-  
- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロオキサゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カ  
ルボニル] - 4- [(5-エチルインドール-2-イ  
ル) スルホニル] ピペラジン

ル) スルホニル] ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(2-シアノエチル)-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-(2-シアノエチル)-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0356】4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(2-シアノエチル)-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-(2-シアノエチル)-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-(N-メチルカルバモイル)ピペラジン

4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-(N-メチルカルバモイル)ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-[[モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]ピペラジン

【0357】4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-[[モルホリン-4-イル)カルボニル]メチル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(2-シアノエチル)-1-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-(2-シアノエチル)-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0358】4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N, N-ジメチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

10 2-[(N, N-ジメチルカルバモイル)メチル]-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(5, 6-ジヒドロベンゾ[f]イソキノリン-8-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5, 6-ジヒドロベンゾ[f]イソキノリン-8-イル)カルボニル]-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(5, 6-ジヒドロピリド[4, 3-f]キナゾリン-3-イル)カルボニル]ピペラジン

【0359】1-[(5, 6-ジヒドロピリド[4, 3-f]キナゾリン-3-イル)カルボニル]-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン

8-[[1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン-4-イル)カルボニル]-5, 6-ジヒドロベンゾ[f]イソキノリン N-オキシド

8-[[1-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン-4-イル)カルボニル]-5, 6-ジヒドロベンゾ[f]イソキノリン N-オキシド

3-[[1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン-4-イル)カルボニル]-5, 6-ジヒドロピリド[4, 3-f]キナゾリン N-オキシド

【0360】1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-ヒドロキシイミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0361】 1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-エチレンジオキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] フラン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-アセトキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-メトキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

【0362】 1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-ジメチルアミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-(ピロリジン-1-yl)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-アセチルアミノ-1-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

1- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-ヒドロキシイミノ-4, 5, 6, 7

-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0363】 1- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-エチレンジオキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

1- [(6-アセトキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

1- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-メトキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

【0364】 1- [(6-ジメチルアミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(6-(ピロリジン-1-yl)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-アセチルアミノ-1-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾール-2-イル) カルボニル] -4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0365】 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] -1- [(6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル]

ル] - 2 - [(モルホリン-4-イル)カルボニルメチル] - 1 - [(6-オキソ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

1 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

1 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(4-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

1 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

【0366】 2 - [(4 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] ピペラジン-1-イル)カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

1 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

1 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(4-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

1 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

2 - [(4 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] ピペラジン-1-イル)カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

【0367】 4 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 2 - (2-シアノエチル) - 1 - [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

4 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 2 - (2-シアノエチル) - 1 - [(4-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

4 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 2 - (2-シアノエチル) - 1 - [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

2 - [(4 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 2 - (2-シアノエチル) ピペラジン-1-イル)カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 2 - (2-シアノエチル) - 1 - [(4, 5,

6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

【0368】 4 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 2 - (2-シアノエチル) - 1 - [(4-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

4 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 2 - (2-シアノエチル) - 1 - [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

2 - [(4 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 2 - (シアノエチル) ピペラジン-1-イル)カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

1 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4, -c] ピリジン-5-イル)カルボニル] ピペラジン

20 1 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4, -c] ピリジン-5-イル)カルボニル] ピペラジン

【0369】 1 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4, -c] ピリジン-5-イル)カルボニル] ピペラジン

1 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4, -c] ピリジン-5-イル)カルボニル] ピペラジン

30 1 - [(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(2-ジメチルアミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-5-イル)カルボニル] ピペラジン

1 - [(2-ジメチルアミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-5-イル)カルボニル] - 4 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] ピペラジン

40 1 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 4 - [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)カルボニル] ピペラジン

【0370】 4 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 1 - [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル)カルボニル] - 2 - (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

50 4 - [(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル] - 1 - [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-

テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (モルホリン-4-イルカルボニルメチル) ピペラジン

2- (2-シアノエチル) -4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ

[5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (N-メチルカルバモイル) ピペラジン

【0371】 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (モルホリン-4-イルカルボニルメチル) ピペラジン

4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (2-シアノエチル) -1- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N-メチルカルバモイル) -1- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (モルホリン-4-イルカルボニルメチル) ピペラジン

【0372】 2- (2-シアノエチル) -4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチルスルホニル 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2-オキソ-ピロリジ

ン-1-イル) エチル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2-オキソ-1, 3-オキサゾラン-3-イル) エチル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2-オキソ-ピロリジ

ン-1-イル) エチル] ピペラジン

4- [(5-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [2- [(クマリン-7-イル) オキシ] エチル] -1- [(6-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0373】 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [2- [(クマリン-7-イル) オキシ] エチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [2- [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] エチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(5-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [2- [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] エチル] -1- [(6-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [2- [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] メチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [2- [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] メチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0374】 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-シアノエチル) -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-シアノエチル) -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペ

50

2-〔2-(アミノスルホニル)エチル〕-4-〔(6



ークロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル]  
-1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ  
チアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
ル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
ルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イ  
ル) カルボニル] -2- [2- [(モルフォリン-4-  
イル) スルホニル] エチル] ピペラジン

2- [2- [(t-ブトキシカルボニルアミノ) スルホ  
ニル] エチル] -4- [(6-クロロベンゾ [b] チ  
エン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-  
4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c]  
ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [2- [(n-ブトキシカルボニルアミノ) スルホ  
ニル] エチル] -4- [(6-クロロベンゾ [b] チ  
エン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-  
4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c]  
ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0379】 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-  
2-イル) スルホニル] -2- [2- (エトキシカルボ  
ニルアミノ) スルホニル] エチル] -1- [(5-メ  
チル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-  
c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [2- (アセチルアミノ) スルホニル] エチル] -  
4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
ルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イ  
ル) カルボニル] ピペラジン

2- (アミノスルホニルメチル) -4- [(6-クロ  
ロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1-  
[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチア  
ゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピ  
ペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
ルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イ  
ル) カルボニル] -2- [(モルフォリン-4-イル)  
スルホニルメチル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
ルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テ  
トラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イ  
ル) カルボニル] -2- [(ピロリジン-1-イル) ス  
ルホニルメチル] ピペラジン

【0380】 2- [(t-ブトキシカルボニルアミノ)  
スルホニルメチル] -4- [(6-クロロベンゾ [b]  
チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル  
-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-  
c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [(n-ブトキシカルボニルアミノ) スルホニルメ

チル] -4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-  
イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5,  
6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジ  
ン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
ルホニル] -2- [(エトキシカルボニルアミノ) ス  
ルホニルメチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-  
テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-  
イル) カルボニル] ピペラジン

10 2- [(アセチルアミノ) スルホニルメチル] -4-  
[(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホ  
ニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラ  
ヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カ  
ルボニル] ピペラジン

2- [3- [(4H-5-アセトキシ-4-オキソ) ピ  
ラン-2-イル] プロピル] -4- [(6-クロロベン  
ゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-  
メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ  
[5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペ  
ラジン

20 【0381】 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-  
2-イル) スルホニル] -2- [3- [(4H-5-ヒ  
ドロキシ-4-オキソ) ピラン-2-イル] プロピル]  
-1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ  
チアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
ル] ピペラジン

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
ルホニル] -2- [3- [(4H-5-メトキシ-4-  
オキソ) ピラン-2-イル] プロピル] -1- [(5-  
メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5,  
4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
N-メチル-N- [[4- [(6-クロロベンゾ [b]  
チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル  
-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-  
c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-  
イル] アセチル] メタンスルホンアミド

30 N- [[4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-  
イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5,  
6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジ  
ン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-イル] アセ  
チル] ベンゼンスルホンアミド

N- [2- [4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-  
2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4,  
5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリ  
ジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン-2-イル]  
エチル] トリフルオロメタンスルホンアミド

【0382】 N-メチル-N- [2- [4- [(6-ク  
ロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1  
- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチア  
ゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル]

ルホニル] - 2 - [2 - (2, 5-ジヒドロ-5-チオ  
キソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イ  
ル) エチル] - 1 - [(5-メチル-4, 5, 6, 7-  
テトラヒドロオキサアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2  
-イル) カルボニル] ピペラジン

【0384】4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-[2-(2-オキソ-1, 3-オキサゾラン-3-イル)エチル]ピペラジン

10 3-オキサゾラン-3-イル) エチル] ピペラジン  
4- [(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニ  
ル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル  
ボニル] -2- [2- (2-オキソ-1, 3-オキサゾ  
ラン-3-イル) エチル] ピペラジン

4-[ (5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2-[2-(2-オキソ-1, 3-オキサゾラン-3-イル) エチル] ピペラジン

20 ゴラン-3-イル) エチル] ピペラジン  
4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニ  
ル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カル  
ボニル] -2- [2-(2-オキソピロリジン1-イ  
ル) エチル] ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニ  
ル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒ  
ドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カル  
ボニル]-2-[(2-(2-オキソピロリジン-1-イ  
ル)エチル)ピペラジン

【0385】4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[[2-(クマリン-7-イル)オキシ]エチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[2-[(クマリン-7-イル)オキシ]エチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[ (5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2-[2-[ (シクロプロピルカルボニル) アミノ] エチル] -1-[ (5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[2-[(シクロプロピルカルボニル)アミノ]エチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

50 2-[(アセチルアミノ)スルホニルメチル]-4-





4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[2-(2, 5-ジヒドロ-5-チオキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)エチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-2-[2-(2, 5-ジヒドロ-5-チオキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)エチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[N-(2-ハイドロキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0398】2-[N, N-ビス-(2-ハイドロキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン  
2-[N, N-ビス-(2-ハイドロキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[N-(2-メトキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[N-(2-メトキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-[N, N-ビス-(2-メトキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0399】2-[N, N-ビス-(2-メトキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4

-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[N-(2-ハイドロキシエチル)-N-メチルカルバモイル]メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[N-(2-ハイドロキシエチル)-N-メチルカルバモイル]メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-[N-ベンジル-N-(2-ハイドロキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-[N-ベンジル-N-(2-ハイドロキシエチル)カルバモイル]メチル]-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0400】4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(2-シアノエチル)-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N-シアノメチル-N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[(N-シアノメチル-N-メチルカルバモイル)メチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-[2-(モルホリン-4-イル)カルボニル]エチル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-[2-(ジメチルアミノカルボニル)エチル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0401】4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[5, 4-c]ピリジン-2-イル)カルボニル]-2-[2-(ピロリジン-1

—イル) カルボニル] エチル] ピペラジン

4—[(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[2—[(モルホリン4-イル) カルボニル] エチル] ピペラジン

4—[(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] —2—[2—(ジメチルアミノカルボニル) エチル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4—[(5-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[2—[(ピロリジン-1-イル) カルボニル] エチル] ピペラジン

2—(3-ブチニル) —4—[(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] —4—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0402】 2—(3-ブチニル) —4—[(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] —4—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4—[(6-クロロ-3-ヒドロキシベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

4—[(6-クロロ-3-ヒドロキシベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

4—[(6-クロロ-3-ヒドロキシベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—(N, N-ジメチルカルバモイルメチル) ピペラジン

4—[(6-クロロ-3-ヒドロキシベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—(N, N-ジメチルカルバモイルメチル) ピペラジン

【0403】 4—[(6-クロロ-3-ヒドロキシベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—(2-シアノエチル) ピペラジン

4—[(6-クロロ-3-ヒドロキシベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—(2-シアノエチル) ピペラジン

4—[(3-アセチル-6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

4—[(3-アセチル-6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

4—[(3-アセチル-6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—(N, N-ジメチルカルバモイルメチル) ピペラジン

【0404】 4—[(3-アセチル-6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—(N, N-ジメチルカルバモイルメチル) ピペラジン

4—[(3-アセチル-6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—(2-シアノエチル) ピペラジン

4—[(6-クロロ-3-(ヒドロキシメチル) シベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

4—[(6-クロロ-3-(ヒドロキシメチル) ベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン

【0405】 4—[(6-クロロ-3-(ヒドロキシメチル) ベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] —1—[(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] —2—[(モルホリン-4-イル) カルボニル] メチル] ピペラジン





- (N, N-ジメチルカルバモイルメチル) ピペラジン  
 4- [(6-クロロ-3-(カルバモイルメチル) ベン  
 ゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-  
 メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾ  
 [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2  
 - (N, N-ジメチルカルバモイルメチル) ピペラジン  
 【0409】 4- [(6-クロロ-3-(カルバモイル  
 メチル) ベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル]  
 -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ  
 チアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニ  
 ル] -2- (2-シアノエチル) ピペラジン  
 4- [(6-クロロ-3-(カルバモイルメチル) ベン  
 ゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(5-  
 メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ  
 [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2  
 - (2-シアノエチル) ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-ヒドロキシインドール-2-  
 イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5,  
 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジ  
 ン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4  
 -イルカルボニル) メチル] ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-ヒドロキシインドール-2-  
 イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5,  
 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジ  
 ン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-  
 イルカルボニル) メチル] ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-ヒドロキシインドール-2-  
 イル) スルホニル] -1- [(5-ヒドロキシメチル-  
 4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c]  
 ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリ  
 ン-4-イルカルボニル) メチル] ピペラジン  
 【0410】 1- [(5-クロロ-3-ヒドロキシイ  
 ンドール-2-イル) スルホニル] -4- [(5-ヒドロ  
 キシメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ  
 [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペ  
 ラジン  
 4- [(5-クロロ-3-ヒドロキシインドール-2-  
 イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5,  
 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジ  
 ン-2-イル) カルボニル] -2- (N, N-ジメチル  
 カルバモイルメチル) ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-ヒドロキシインドール-2-  
 イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5,  
 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジ  
 ン-2-イル) カルボニル] -2- (N, N-ジメチルカ  
 ルバモイルメチル) ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-ヒドロキシインドール-2-  
 イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5,  
 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジ  
 ン-2-イル) カルボニル] -2- (2-シアノエチ

ル) ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-ヒドロキシインドール-2-  
 イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5,  
 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジ  
 ン-2-イル) カルボニル] -2- (2-シアノエチル)  
 ピペラジン  
 【0411】 4- [(3-アセチル-5-クロロイン  
 ドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-  
 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-  
 c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モル  
 ホリン-4-イルカルボニル) メチル] ピペラジン  
 4- [(3-アセチル-5-クロロインドール-2-イ  
 ル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6,  
 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-  
 イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル  
 カルボニル) メチル] ピペラジン  
 4- [(3-アセチル-5-クロロインドール-2-イ  
 ル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6,  
 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-  
 2-イル) カルボニル] -2- (N, N-ジメチルカル  
 バモイルメチル) ピペラジン  
 4- [(3-アセチル-5-クロロインドール-2-イ  
 ル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6,  
 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c] ピリジン-2-  
 イル) カルボニル] -2- (N, N-ジメチルカルバ  
 モイルメチル) ピペラジン  
 4- [(3-アセチル-5-クロロインドール-2-イ  
 ル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6,  
 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-c] ピリジン-  
 2-イル) カルボニル] -2- (2-シアノエチル) ピ  
 ペラジン  
 【0412】 4- [(3-アセチル-5-クロロイン  
 ドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-  
 4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c]  
 ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (2-シアノ  
 エチル) ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-(ヒドロキシメチル) インド  
 ール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-  
 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-  
 c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モル  
 ホリン-4-イルカルボニル) メチル] ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-(ヒドロキシメチル) インド  
 ール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-  
 4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [5, 4-c]  
 ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリ  
 ン-4-イルカルボニル) メチル] ピペラジン  
 4- [(5-クロロ-3-(ヒドロキシメチル) インド  
 ール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-  
 4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ [5, 4-  
 c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (N, N



ージメチルカルバモイルメチル] ピペラジン

4- [(5-クロロ-3-(カルバモイルメチル) インドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (2-シアノエチル) ピペラジン

4- [(5-クロロ-3-(カルバモイルメチル) インドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- (2-シアノエチル) ピペラジン

【0417】 4- [(5-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5-クロロ-1-メトキシインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [(5-クロロ-1-メトキシインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [4- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

【0418】 4- [4- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [4- [(6-クロロ-1-メトキシインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

4- [4- [(6-クロロ-1-メトキシインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾ [5, 4-c] ピ

リジン-2-イル) カルボニル] -2- [(モルホリン-4-イル) カルボニルメチル] ピペラジン

1- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

4- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] -1- [(5-メチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ [5, 4-c] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0419】 1- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [d] チアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0420】 2- [4- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

1- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(オキサゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロ-1-ヒドロキシインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] オキサゾ [4, 5-b] ピリジン N-オキシド

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(オキサゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] オキサゾ [4, 5-b] ピリジン N-オキシド

【0421】 1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(オキサゾ [4, 5

-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 2-[ [4-[ (6-クロロベンゾ [b] チエン-2-  
 イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニ  
 ル] オキサゾロ [4, 5-b] ピリジン N-オキシド  
 1-[ (6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニ  
 ル] -4-[ (オキサゾロ [4, 5-b] ピリジン-2-  
 イル) カルボニル] ピペラジン  
 2-[ [4-[ (6-クロロナフタレン-2-イル) ス  
 ルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] オキサ  
 ザロ [4, 5-b] ピリジン N-オキシド  
 1-[ (5-プロモインドール-2-イル) スルホニ  
 ル] -4-[ (オキサゾロ [4, 5-b] ピリジン-2-  
 イル) カルボニル] ピペラジン  
 【0422】 2-[ [4-[ (5-プロモインドール-  
 2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボ  
 ニル] オキサゾロ [4, 5-b] ピリジン N-オキシ  
 ド  
 1-[ (5-エチルインドール-2-イル) スルホニ  
 ル] -4-[ (オキサゾロ [4, 5-b] ピリジン-2-  
 イル) カルボニル] ピペラジン  
 2-[ [4-[ (5-エチルインドール-2-イル)  
 スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] オキサ  
 ザロ [4, 5-b] ピリジン N-オキシド  
 4-[ (5-クロロインドール-2-イル) スルホニ  
 ル] -2-(N, N-ジメチルカルバモイルメチル) -  
 1-[ (オキサゾロ [4, 5-b] ピリジン-2-イル  
 ル) カルボニル] ピペラジン  
 2-[ [4-[ (5-クロロインドール-2-イル) ス  
 ルホニル] -2-(N, N-ジメチルカルバモイルメチ  
 ル) ピペラジン-1-イル] カルボニル] オキサゾロ  
 [4, 5-b] ピリジン N-オキシド  
 【0423】 4-[ (6-クロロベンゾ [b] チエン-  
 2-イル) スルホニル] -2-(N, N-ジメチルカル  
 バモイルメチル) -1-[ (オキサゾロ [4, 5-b]  
 ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 2-[ [4-[ (6-クロロベンゾ [b] チエン-2-  
 イル) スルホニル] -2-(N, N-ジメチルカルバモ  
 イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル] オキサ  
 ザロ [4, 5-b] ピリジン N-オキシド  
 2-(N, N-ジメチルカルバモイルメチル) -4-  
 [ (5-エチルインドール-2-イル) スルホニル]  
 -1-[ (オキサゾロ [4, 5-b] ピリジン-2-イル  
 ル) カルボニル] ピペラジン  
 2-[ [2-(N, N-ジメチルカルバモイルメチル)  
 -4-[ (5-エチルインドール-2-イル) スルホ  
 ニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] オキサゾロ  
 [4, 5-b] ピリジン N-オキシド  
 4-[ (6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
 ルホニル] -2-[ (N, N-ジメチルカルバモイル)  
 メチル] -1-[ (6-ヒドロキシ-4, 5, 6, 7-

テトラヒドロベンゾ [d] チアゾール-2-イル) カル  
 ボニル] ピペラジン  
 【0424】 4-[ (5-クロロインドール-2-イル  
 ル) スルホニル] -1-[ (5, 6-ジメチル-4,  
 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ [4, 5-d] ピリ  
 ダジン-2-イル) カルボニル] -2-[ 2-(イミダ  
 ザール-1-イル) エチル] ピペラジン  
 4-[ (6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
 ルホニル] -1-[ (5, 6-ジメチル-4, 5, 6,  
 7-テトラヒドロチアゾロ [4, 5-d] ピリダジン-  
 2-イル) カルボニル] -2-[ 2-(イミダゾール-  
 1-イル) エチル] ピペラジン  
 4-[ (6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニ  
 ル] -1-[ (5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テ  
 トラヒドロチアゾロ [4, 5-d] ピリダジン-2-イル  
 ル) カルボニル] -2-[ 2-(イミダゾール-1-イル  
 ル) エチル] ピペラジン  
 4-[ (5-クロロインドール-2-イル) スルホニ  
 ル] -1-[ (6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4,  
 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2-  
 (メチルカルバモイル) ピペラジン  
 4-[ (6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
 ルホニル] -1-[ (6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ  
 [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -  
 2-(メチルカルバモイル) ピペラジン  
 【0425】 4-[ (6-クロロナフタレン-2-イル  
 ル) スルホニル] -1-[ (6, 7-ジヒドロ-4H-  
 ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニ  
 ル] -2-(メチルカルバモイル) ピペラジン  
 4-[ (5-クロロインドール-2-イル) スルホニ  
 ル] -1-[ (6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4,  
 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2-  
 (2-モルホリノエチル) ピペラジン  
 4-[ (5-クロロインドール-2-イル) スルホニ  
 ル] -1-[ (6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4,  
 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2-  
 [ 2-(イミダゾール-1-イル) エチル] ピペラジン  
 4-[ (6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) ス  
 ルホニル] -1-[ (6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ  
 [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -  
 2-[ 2-(イミダゾール-1-イル) エチル] ピペラ  
 ジン  
 4-[ (6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニ  
 ル] -1-[ (6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4,  
 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2-  
 [ 2-(イミダゾール-1-イル) エチル] ピペラジン  
 【0426】 4-[ (5-クロロインドール-2-イル  
 ル) スルホニル] -1-[ (6, 7-ジヒドロ-4H-  
 ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニ  
 ル] -2-[ 2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-

141

1-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (1H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (1H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル) エチル] ピペラジン  
 【0427】 4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (1H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-2-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-2-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-2-イル) エチル] ピペラジン  
 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (2-シアノエチル) -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 【0428】 4- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -1- [(6, 7-ジヒドロ-4H-ピラノ [4, 3-d] チアゾール-2-イル) カルボニル] -2- [2- (2H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル) エチル] ピペラジン

142

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 2- [4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド  
 1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 2- [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド  
 【0429】 1- [(6-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 2- [4- [(6-エチニルインドール-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド  
 1- [(6-エチニルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 2- [4- [(6-エチニルベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド  
 1- [(6-エチニルナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 【0430】 2- [4- [(6-エチニルナフタレン-2-イル) スルホニル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド  
 4- [(6-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (N, N-ジメチルカルバモイル) メチル-1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 2- [4- [(6-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド  
 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (N, N-ジメチルカルバモイル) メチル-1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン  
 2- [4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド  
 【0431】 4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- (N, N-ジメチルカルバモイル) メチル-1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [(N, N-ジメチルカルバモイル) メチル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ

[3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4- [(6-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(ピロリジン-1-イル) カルボニルメチル] -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- [(ピロリジン-1-イル) カルボニルメチル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ

[3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [(ピロリジン-1-イル) カルボニルメチル] -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0432】 2- [4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- [(ピロリジン-1-イル) カルボニルメチル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [(ピロリジン-1-イル) カルボニルメチル] -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- [(ピロリジン-1-イル) カルボニルメチル] ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4- [(6-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシエチル) -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシエチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

【0433】 4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシエチル) -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシエチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシエチル) -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スル

ホニル] -2- (2-ヒドロキシエチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4- [(6-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシメチル) -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0434】 2- [4- [(6-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシメチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシメチル) -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシメチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシメチル) -1- [(チエノ [3, 2-b] ピリジン-2-イル) カルボニル] ピペラジン

2- [4- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -2- (2-ヒドロキシメチル) ピペラジン-1-イル] カルボニル] チエノ [3, 2-b] ピリジン N-オキシド

【0435】 1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6, 7-ジヒドロ-4-H-ピラノ [3, 4-d] イミダゾロ-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(5-クロロインドール-2-イル) スルホニル] -4- [(6, 7-ジヒドロ-4-H-ピラノ [4, 3-d] イミダゾロ-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(6, 7-ジヒドロ-4-H-ピラノ [3, 4-d] イミダゾロ-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロベンゾ [b] チエン-2-イル) スルホニル] -4- [(6, 7-ジヒドロ-4-H-ピラノ [4, 3-d] イミダゾロ-2-イル) カルボニル] ピペラジン

1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(6, 7-ジヒドロ-4-H-ピラノ [3, 4-d] イミダゾロ-2-イル) カルボニル] ピペラジン

【0436】 1- [(6-クロロナフタレン-2-イル) スルホニル] -4- [(6, 7-ジヒドロ-4-H-ピラノ [4, 3-d] イミダゾロ-2-イル) カルボ

ニル] ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(4-オキソ-3, 4-ジヒドロチエノ[3, 2-d]ピリミジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(4-オキソ-3, 4-ジヒドロチエノ[3, 2-d]ピリミジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(4-オキソ-3, 4-ジヒドロチエノ[3, 2-d]ピリミジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(2, 3-ジヒドロ-1-H-チエノ[2, 3-b][1, 4]オキサジン-6-イル)カルボニル]ピペラジン

【0437】1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(2, 3-ジヒドロ-1-H-チエノ[2, 3-b][1, 4]オキサジン-6-イル)カルボニル]ピペラジン 20

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(2, 3-ジヒドロ-1-H-チエノ[2, 3-b][1, 4]オキサジン-6-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-b]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-b]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン 30

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(4, 5, 6, 7-テトラヒドロチアゾロ[4, 5-b]ピリジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0438】1-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-4-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン 40

1-[(6-クロロナフタレン-2-イル)スルホニル]-4-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-プロモインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-4-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テ

ラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-2-(N, N-ジメチルカルバモイルメチル)-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0439】4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-2-(N, N-ジメチルカルバモイルメチル)-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

2-(N, N-ジメチルカルバモイルメチル)-4-[(5-エチニルインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]-2-[2-(テトラゾール-1-イル)エチル]ピペラジン

4-[(6-クロロベンゾ[b]チエン-2-イル)スルホニル]-2-(2-シアノエチル)-1-[(5, 6-ジメチル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロオキサゾロ[4, 5-d]ピリダジン-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-4-[[6-(ピリリドン-1-イル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ[d]チアゾール-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0440】1-[(6-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ[d]チアゾール-2-イル)カルボニル]-4-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(6-N-ホルミルアミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ[d]チアゾール-2-イル)カルボニル]ピペラジン

1-[(5-クロロインドール-2-イル)スルホニル]-1-[(6-スルホンアミド-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ[d]チアゾール-2-イル)カルボニル]ピペラジン

【0441】本発明においては、上記の化合物のみならず、上記化合物の塩、それらの溶媒和物も好ましいものとして挙げることができる。

【0442】以下に、本発明の一般式(I)で表される化合物(スルホニル誘導体)の製造方法について説明する。

【0443】本発明の一般式(I)で表される化合物、その塩およびそれらの溶媒和物は、既知の一般的化学的な製造方法の組み合わせにより製造することができ、以下に代表的な合成法を説明する。

【0444】なお、本発明のスルホニル誘導体を合成する際に、窒素原子、水酸基、カルボキシル基等の置換基を保護する必要がある場合には、従来より知られている必要な時に除去出来る一般的な保護基により保護されていても良く、これらの保護基は必要な時に以下の製造方法に示す有機化学的一般的な方法により除去できる。また、本発明のスルホニル誘導体を合成するために必要となる原料は、有機化学の一般的合成法により得ることができ、代表的な原料の製造方法を参考例に示す。さらに、本発明のスルホニル誘導体の原料は参考例に例示した方法を応用することにより合成することができる。

【0445】以下に、窒素原子、水酸基、カルボキシル基等の置換基の保護基および脱保護の方法について述べる。

【0446】アミノ基、アルキルアミノ基における窒素原子の適当な保護基としては、通常のアシル型保護基、すなわちアセチル基のごときアルカノイル基、もしくはメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、第三級ブトキシカルボニル基のごときアルコキシカルボニル基、もしくはベンジルオキシカルボニル基、パラメトキシベンジルオキシカルボニル基、パラ(オルト)ニトロベンジルオキシカルボニル基のごときアリールメトキシカルボニル基、ベンジル基、トリフェニルメチル基のごときアリールメチル基もしくはベンゾイル基のごときアロイル基が適当である。これら保護基の脱保護の方法は、採用された保護基の化学的性質により異なり、例えば、アルカノイル基、アルコキシカルボニル基あるいはアロイル基のようなアシル型保護基では、水酸化リチウム、水酸化ナトリウムもしくは水酸化カリウムのような水酸化アルカリ金属等の適当な塩基を使うことにより加水分解し脱保護できる。

【0447】また、第三級ブトキシカルボニル基もしくはパラメトキシベンジルオキシカルボニル基のような置換メトキシカルボニル型保護基は、適当な酸、例えば酢酸、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸あるいはこれらの酸の組み合わせにより除去できる。また、ベンジルオキシカルボニル基、パラメトキシベンジルオキシカルボニル基、パラ(オルト)ニトロベンジルオキシカルボニル基のようなアリールメトキシカルボニル基ならびベンジル基のごときアリールメチル基はパラジウム炭素触媒を用いる加水素分解により除去することができる。また、ベンジル基は、液体アンモニア中、金属ナトリウムを用いるバーチ還元によりベンジル基の除去を行い、窒素-水素結合に変換できる。トリフェニルメチル基は、適当な酸、例えば炭酸、酢酸、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン

酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸あるいはこれらの酸の組み合わせにより除去できる。また、液体アンモニア中、金属ナトリウムを用いるバーチ還元により除去することができ、パラジウム炭素触媒を用いる加水素分解により除去することもできる。

【0448】その他のアミノ基の保護基としては、1級アミノ基の場合フタロイル基型に保護することができ、ヒドラジン、ジメチルアミノプロピルアミンなどにより除去できる。インドールの窒素原子は、フェニルスルホニル基、トルエンスルホニル基、アセチル基、トリフルオロアセチル基等で保護することができ、水酸化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化カリウムのような水酸化アルカリ金属等の適当な塩基を使うことにより加水分解し脱保護できる。

【0449】水酸基の適当な保護基としてはアシル型保護基、エーテル型保護基、が挙げられる。アシル型保護基としては、アセチル基などのアルカノイル基、ベンゾイル基などのアロイル基が適当であり、エーテル型保護基としてはベンジル基などのアリールメチル基、第三ブチルジメチルシリル基などのシリルエーテル基、メトキシメチル基、テトラヒドロピラニル基などが挙げられる。これらの保護基の除去は採用された保護基の化学的性質により異なる。例えば、アルカノイル基およびアロイル基などのアシル基は水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化アルカリ金属などの適当な塩基で加水分解することにより除去できる。アリールメチル型保護基はパラジウム炭素触媒を用いる加水素分解により除去することができ、第三級ブチルジメチルシリル基などのシリル基は、テトラブチルアンモニウムフルオリド等の弗化水素酸塩により除去できる。また、メトキシメチル基、テトラヒドロピラニル基などは酢酸、塩酸などにより除去できる。また、アリール基に置換した水酸基はメチル基により保護でき、塩化アルミニウム、三臭化硼素、三臭化燐のようなルイス酸、トリメチルシリルヨード、臭化水素などにより除去できる。

【0450】カルボキシル基はエステル化することにより保護することができる。メチル、エチルエステルなどでは水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化アルカリ金属などの適当な塩基で加水分解することにより、第三ブチルエステルではトリフルオロ酢酸あるいは塩酸で処理することにより第三ブチル基を除去できる。また、ベンジル基などのアリールメチル基型エステルではパラジウム炭素触媒を用いる加水素分解によりアリールメチル基を除去することができる。

【0451】アセチレンの保護基としては、トリメチルシリル基、第三ブチルジメチルシリル基、第三ブチルジフェニルシリル基等のアルキルシリル基が利用でき、水酸化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化カリウムのような水酸化アルカリ金属等の適当な塩基、あるいはテト